

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
30. Mai 2003 (30.05.2003)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
WO 03/043993 A1

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: C07D 239/46,  
239/48, 239/42, 239/52, 403/12, A01N 43/54

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP02/12807

(22) Internationales Anmeldedatum:  
15. November 2002 (15.11.2002)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
101 56 279.9 19. November 2001 (19.11.2001) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme  
von US): BASF AKTIENGESSELLSCHAFT [DE/DE];  
67056 Ludwigshafen (DE).

(72) Erfinder; und

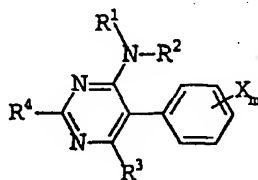
(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): GYPSE, Andreas  
[DE/DE]; B 4 4, 68159 Mannheim (DE). GROTE,

Thomas [DE/DE]; Im Hoehenhausen 18, 67157  
Wachenheim (DE). SCHWÖGLER, Anja [DE/DE];  
Heinrich-Lanz-Strasse 3, 68165 Mannheim (DE).  
RHEINHEIMER, Joachim [DE/DE]; Merziger Str.  
24, 67063 Ludwigshafen (DE). SCHIEWECK, Frank  
[DE/DE]; Lindenweg 4, 67258 Hessheim (DE). TORMO  
I BLASCO, Jordi [ES/DE]; Mühlweg 47, 67117 Lim-  
burgerhof (DE). ROSE, Ingo [DE/DE]; C 2, 19, 68159  
Mannheim (DE). SCHÄFER, Peter [DE/DE]; Römerstr.  
1, 67308 Ottersheim (DE). GEWEHR, Markus [DE/DE];  
Goethestrasse 21, 56288 Kastellaun (DE). GRAM-  
MENOS, Wassilios [GR/DE]; Samuel Hahnmann  
Weg 9, 67071 Ludwigshafen (DE). MÜLLER, Bernd  
[DE/DE]; Stockingerstrasse 7, 67227 Frankenthal (DE).  
AMMERMAN, Eberhard [DE/DE]; Von-Gagem-Str.  
2, 64646 Heppenheim (DE). STRATHMANN, Siegfried  
[DE/DE]; Donnersbergstr. 9, 67117 Limburgerhof (DE).  
LORENZ, Gisela [DE/DE]; Erlenweg 13, 67434 Ham-  
bach (DE). STIERL, Reinhard [DE/DE]; Ginsterstr. 17,  
67112 Mutterstadt (DE).

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: 5-PHENYLPYRIMIDINES, AGENTS COMPRISING THE SAME, METHOD FOR PRODUCTION AND USE  
THEREOF

(54) Bezeichnung: 5-PHENYLPYRIMIDINE, VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG, SIE ENTHALTENDE MITTEL  
UND IHRE VERWENDUNG



(I)

(57) Abstract: 5-Phenylpyrimidines of formula (I), where the substituents and the indices have the following meanings: R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> = H, alkyl, haloalkyl, cycloalkyl, halocycloalkyl, alkenyl, haloalkenyl, alkynyl or haloalkynyl, where R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> together with the nitrogen atom to which they are bonded may form a saturated or unsaturated ring, interrupted by an ether, thio, sulfoxy or sulphonyl group and which can be substituted by one to four groups R<sup>a</sup> and/or R<sup>b</sup>, R<sup>3</sup> = H, halo, cyano, alkyl, haloalkyl, alkoxy, haloalkoxy or alkenyloxy, R<sup>4</sup> = H, halo, cyano, hydroxy, mercapto, azido, alkyl, alkenyl, alkynyl, haloalkyl, alkoxy, alkenyloxy, alkynyloxy, haloalkoxy, alkylthio, alkenylthio, alkynylthio, haloalkylthio, -ON=CR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -CR<sup>c</sup>=NOR<sup>a</sup>, -NR<sup>c</sup>N=CR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -NR<sup>c</sup>NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -NOR<sup>a</sup>, -NR<sup>c</sup>C (=NR<sup>c</sup>) NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -NR<sup>c</sup>C (=O) NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -NR<sup>c</sup>C (=O) R<sup>c</sup>, -NR<sup>c</sup>C (=NOR<sup>c</sup>) R<sup>c</sup>, -OC (=O) R<sup>c</sup>, -C (=NOR<sup>c</sup>) NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -CR<sup>c</sup> (=NNR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>), -C (=O) NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup> or -C (=O) R<sup>c</sup>, where R<sup>a</sup>, R<sup>b</sup>, R<sup>c</sup> are as defined in the description, X = halo, alkyl, alkoxy or haloalkyl and m = a whole number from 1 to 5. The invention further relates to methods for production of the above compounds, agents containing the same and use thereof for the treatment of noxious mycoses.

WO 03/043993 A1

(57) Zusammenfassung: 5-Phenylpyrimidine der Formel (I), in der die Substituenten und der Index folgende Bedeutung haben: R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Halogenalkyl, Alkenyl, Halogenalkenyl, Alkynyl oder Halogenalkynyl, R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gesättigten oder ungesättigten Ring bilden, der durch eine Ether-, Thio-, Sulfoxyloder Sulfonyl-Gruppe unterbrochen sein und durch eine bis vier Gruppen R<sup>a</sup> and/oder R<sup>b</sup> substituiert sein kann; R<sup>3</sup> Wasserstoff, Halogen, Cyano, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy oder Alkenyloxy; R<sup>4</sup> Wasserstoff, Halogen, Cyano, Hydroxy, Mercapto, Azido, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkynyloxy, Haloalkoxy, Alkylthio, Alkenylthio, Alkynylthio, Halogenalkylthio, -ON=CR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -CR<sup>c</sup>=NOR<sup>a</sup>, -NR<sup>c</sup>N=CR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -NR<sup>c</sup>NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -NOR<sup>a</sup>, -NR<sup>c</sup>C (=NR<sup>c</sup>) NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -NR<sup>c</sup>C (=O) NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -NR<sup>c</sup>C (=O) R<sup>c</sup>, -NR<sup>c</sup>C (=NOR<sup>c</sup>) R<sup>c</sup>, -OC (=O) R<sup>c</sup>, -C (=NOR<sup>c</sup>) NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -CR<sup>c</sup> (=NNR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>), -C (=O) NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup> oder -C (=O) R<sup>c</sup>; worin R<sup>a</sup>, R<sup>b</sup>, R<sup>c</sup> gemäß der Beschreibung definiert sind; X Halogen, Alkyl, Alkoxy oder Haloalkyl; und m eine ganze Zahl von 1 bis 5; Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie deren Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen.



(74) **Gemeinsamer Vertreter:** BASF AKTIENGESSELLSCHAFT; 67056 Ludwigshafen (DE).

(81) **Bestimmungsstaaten (national):** AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) **Bestimmungsstaaten (regional):** ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),

eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

**Veröffentlicht:**

— mit internationalem Recherchenbericht

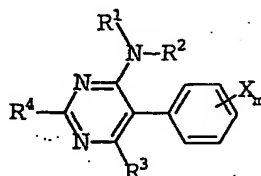
*Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.*

## Beschreibung

5-Phenylpyrimidine, Verfahren zu ihrer Herstellung, sie enthal-  
5 tende Mittel und ihre Verwendung

Die vorliegende Erfindung betrifft 5-Phenylpyrimidine der Formel  
I

10



I

15 in der die Substituenten und der Index folgende Bedeutung haben:

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> unabhängig voneinander Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogencycloal-  
kyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl oder  
20 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkynyl,

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an  
das sie gebunden sind, einen gesättigten oder ungesättigten  
fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch eine  
25 Ether-(-O-), Thio-(-S-), Sulfoxyl-(-S[=O]-) oder  
Sulfonyl-(-SO<sub>2</sub>-) Gruppe unterbrochen sein und/oder durch  
eine bis vier Gruppen R<sup>a</sup> und/oder R<sup>b</sup> substituiert sein kann;

R<sup>a</sup>, R<sup>b</sup> unabhängig voneinander Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Al-  
30 kenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy,

C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-Cycloalkyl, Phenyl oder fünf- bis zehngliedriger  
gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer He-  
35 terocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der  
Gruppe O, N oder S, wobei die cyclischen Reste teilweise  
oder vollständig substituiert sein können durch folgende  
Gruppen R<sup>x</sup>:

40 R<sup>x</sup> unabhängig voneinander Cyano, Nitro, Amino, Amino-  
carbonyl, Aminothiocarbonyl, Halogen, Hydroxy,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl-  
carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfoxyl,  
C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy,  
45 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyloxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alky-  
lamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino-  
carbonyl, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylaminocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl-

aminothiocarbonyl, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylaminothiocarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, Phenyl, Phenoxy, Benzyl, Benzyloxy, 5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl, 5- oder 6-gliedriges Hetaryl, 5- oder 6-gliedriges Hetaryloxy, C(=NOR<sup>a</sup>)-OR<sup>b</sup> oder OC(R<sup>a</sup>)<sub>2</sub>-C(R<sup>b</sup>)=NOR<sup>b</sup>,

wobei die cyclischen Gruppen ihrerseits unsubstituiert oder substituiert sind durch einen bis drei Reste R<sup>v</sup>:

R<sup>v</sup> Cyano, Nitro, Halogen, Hydroxy, Amino, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfoxyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylamino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylaminocarbonyl, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylaminocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylaminothiocarbonyl, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylaminothiocarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyl, Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Benzyl, Benzyloxy, 5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl, 5- oder 6-gliedriges Hetaryl, 5- oder 6-gliedriges Hetaryloxy oder C(=NOR<sup>a</sup>)-OR<sup>b</sup>;

R<sup>a</sup>, R<sup>b</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl;

R<sup>a</sup> und R<sup>b</sup> können auch gemeinsam über eine Alkylen- oder Alkenylenkette mit dem überbrückenden Atom einen gesättigten oder ungesättigten fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden;

R<sup>3</sup> Wasserstoff, Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy oder C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyloxy;

R<sup>4</sup> Wasserstoff, Halogen, Cyano, Hydroxy, Mercapto, Azido, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenylthio, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, -ON=CR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -CR<sup>c</sup>=NOR<sup>a</sup>, -NR<sup>c</sup>N=CR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -NR<sup>c</sup>NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -NOR<sup>a</sup>, -NR<sup>c</sup>C(=NR<sup>c'</sup>)NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -NR<sup>c</sup>C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -NR<sup>a</sup>C(=O)R<sup>c</sup>, -NR<sup>a</sup>C(=NOR<sup>c</sup>)R<sup>c'</sup>, -OC(=O)R<sup>c</sup>, -C(=NOR<sup>c</sup>)NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -CR<sup>c</sup>(=NNR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>), -C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup> oder -C(=O)R<sup>c</sup>;

$R^c$  eine der bei  $R^a$  und  $R^b$  genannten monovalenten Gruppen;

5 X Halogen,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy oder  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl;  
und

m eine ganze Zahl von 1 bis 5.

Außerdem betrifft die Erfindung Verfahren zur Herstellung dieser  
10 Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie deren Verwendung zur  
Bekämpfung von Schadpilzen.

Pyridylpyrimidin-Derivate mit fungizider Wirkung sind bekannt aus  
EP-A 407 899 DE-A 42 27 811 und WO-A 92/10490. Tetrahydropyrimi-  
15 din-Derivate mit fungizider Wirkung sind aus GB-A 2 277 090 be-  
kannt.

Die in den vorstehend genannten Schriften beschriebenen Verbindungen sind als Pflanzenschutzmittel gegen Schadpilze geeignet.

20

Ihre Wirkung ist jedoch in vielen Fällen nicht zufriedenstellend. Daher lag als Aufgabe zugrunde, Verbindungen mit verbesserter Wirksamkeit zu finden.

25 Demgemäß wurden die eingangs definierten Phenylpyrimidinderivate I gefunden. Außerdem wurden Verfahren zu ihrer Herstellung sowie sie enthaltende Mittel zur Bekämpfung von Schadpilzen und ihre Verwendung in diesem Sinne gefunden.

30 Die Verbindungen der Formel I weisen eine gegenüber den bekannten Verbindungen erhöhte Wirksamkeit gegen Schadpilze auf.

Die Verbindungen I können auf verschiedenen Wegen erhalten werden.

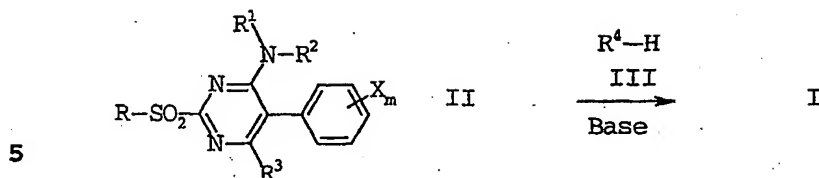
35

Vorteilhaft geht man zur Herstellung der Verbindungen der Formel I, in der  $R^4$  für Cyanoo oder eine über ein Heteroatom gebundene Gruppe steht, von Sulfonen der Formel II aus. In Formel II haben die Substituenten  $X_m$  und  $R^1$  bis  $R^3$  die Bedeutung wie in Formel I

40 und R steht für  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl, bevorzugt für Methyl.

Die Sulfone der Formel II werden mit Verbindungen der Formel III unter basischen Bedingungen umgesetzt. Aus praktischen Gründen kann alternativ direkt das Alkalimetall-, Erdalkalimetall- oder

45 Ammoniumsalz der Verbindung III eingesetzt werden.



Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 25°C bis 250°C, vorzugsweise 40°C bis 210°C, in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base [vgl. DE-A 39 01 084; 10 Chimia, Bd. 50, S. 525-530 (1996); Khim. Geterotsikl. Soedin, Bd. 12, S. 1696-1697 (1998)].

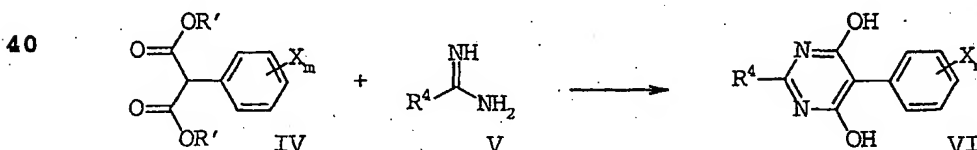
Geeignete Lösungsmittel sind halogenierte Kohlenwasserstoffe, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, 15 1,2-Dimethoxyethan, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid. Besonders bevorzugt werden Ethanol, Dichlormethan, Acetonitril und Tetrahydrofuran. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

20

Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydroxide wie Lithiumhydroxid, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid und Calciumhydroxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride wie Lithiumhydrid, Natriumhydrid, Kalium- 25 hydrid und Calciumhydrid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate wie Lithiumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat in Betracht. Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch im Überschuß verwendet werden.

30 Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, III in bis zu 10fachem, insbesondere bis zu 3fachem Überschuß bezogen auf II einzusetzen.

35 Verbindungen der Formel I, in der R<sup>4</sup> für Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl oder Halogenalkyl steht, werden vorteilhaft aus Phenylmalonestern der Formel IV durch Umsetzung mit Amidinen der Formel V erhalten.



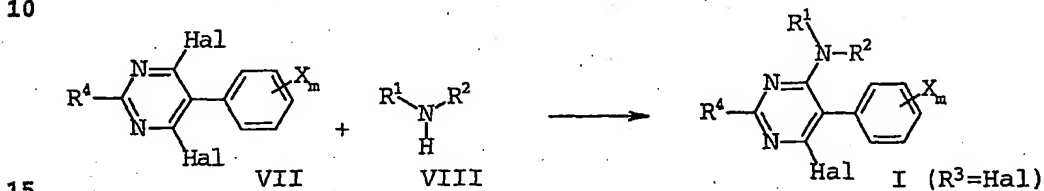
Diese Umsetzung erfolgt vorteilhaft unter den aus J. Chem. Soc. 45 (1943) S. 388 und J. Org. Chem. (1952) Bd. 17, S. 1320 bekannten Bedingungen.

Phenylmalonester der Formel IV sind aus EP-A 10 02 788 bekannt.

Hydroxypyrimidine der Formel VI werden in Halogenverbindungen VII überführt [vgl. J. Chem. Soc. (1943) S. 383; Helv. Chim. Acta 5 (1981) Bd. 64, S. 113-152]. Als Halogenierungsmittel kommen dabei insbesondere POCl<sub>3</sub> und POBr<sub>3</sub> in Betracht.

Aus Halogenpyrimidinen VII werden durch Umsetzung mit Aminen VIII Verbindungen der Formel I erhalten.

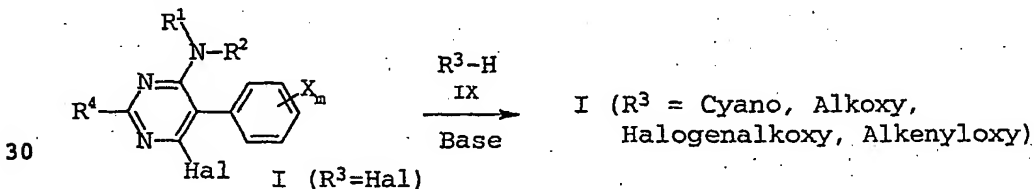
10



15

Diese Umsetzung erfolgt vorteilhaft unter den aus J. Chem. Soc. (1943) S. 383 und Chem. Eur. J. (1999) Bd. 5 (12), S. 3450-3458 bekannten Bedingungen.

20 Phenylpyrimidine der Formel I, in der R<sup>3</sup> für Cyano oder über Sauerstoff gebundene Gruppen steht, werden vorteilhaft aus den entsprechenden Halogenverbindungen der Formel I durch Umsetzung mit Verbindungen IX unter basischen Bedingungen erhalten. Aus praktischen Gründen kann alternativ direkt das Alkalimetall-, Erdalkalimetall- oder Ammoniumsalz der Verbindung IX eingesetzt werden.



30

Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 25°C bis 250°C, vorzugsweise 40°C bis 210°C, in einem inerten organischen Lösungsmittel ggf. in Gegenwart einer Base [vgl. Recl.

35 Trav. Chim. Pays-Bas (1942) Bd. 61, S. 291; J. Heterocycl. Chem. (1993) Bd. 30 (4), S. 993-995].

Geeignete Lösungsmittel sind Ether, Sulfoxide, Amide, besonders bevorzugt Dimethylsulfoxid, N,N-Dimethylformamid, N-Methylpyrrolidon, N N-Dimethylacetamid, Diethylether, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

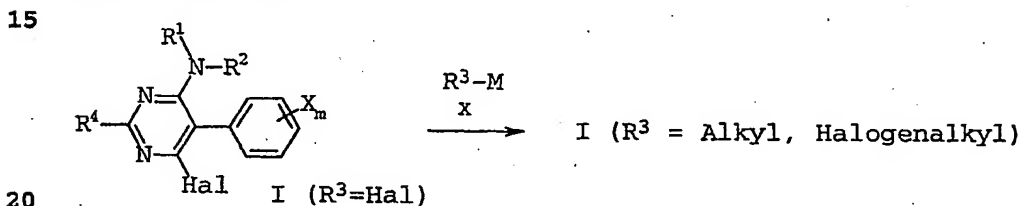
Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydroxide wie Lithiumhydroxid, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid und Calciumhydroxid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride wie Lithiumhydrid, Natriumhydrid, Kalium-

45

hydrid und Calciumhydrid, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate wie Lithiumcarbonat, Kaliumcarbonat und Calciumcarbonat in Betracht.

- 5 Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch im Überschuß verwendet werden.

- Phenylpyrimidine der Formel I, in der  $R^3$  für  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl oder,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl steht, werden vorteilhaft aus den entsprechenden  
 10 den Halogenverbindungen der Formel I durch Umsetzung mit metallorganischen Verbindungen der Formel X, in der M für eine Gruppe Mg-Hal, Zn- $R^3$  oder  $B(OR)_2$  steht, wobei Hal ein Halogenatom und R Wasserstoff oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl bedeutet und  $R^3$  für  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl steht, erhalten.



- Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von  $-25^\circ\text{C}$  bis  $250^\circ\text{C}$ , vorzugsweise  $0^\circ\text{C}$  bis  $150^\circ\text{C}$ , in einem inerten organischen Lösungsmittel, ggf. in Gegenwart eines Übergangsmetallkatalysators [vgl. Chem. and Pharm. Bull. (1980) Bd. 28, Nr. 2, S.  
 25 571-577; Tetrahedron Lett. (1996) Bd. 37 (8), S. 1309; Tetrahedron Lett. (1994) Bd. 35 (19), S. 3155; Synlett (1999) Bd. 7, S. 1145].

- Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe,  
 30 aromatische Kohlenwasserstoffe, Ether, besonders bevorzugt Diethylether, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, Benzol, Toluol und Xylol. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet werden.

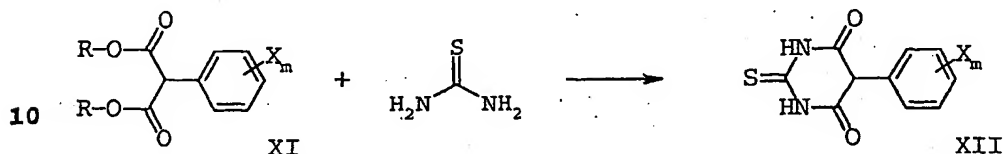
- Als Übergangsmetall-Katalysatoren sind Eisen-, Kobalt-, Nickel-, Rhodium-, Platin- oder Palladium-Verbindungen, besonders Nickel(0)-, Nickel(II)- Palladium(0)- und Palladium(II)-Verbindungen geeignet. Dabei können Salze wie Palladiumchlorid oder Palladiumacetat oder auch Pd-Komplexe verwendet werden. Voraus-  
 40 setzung ist nur, daß die Liganden am Palladium unter den Reaktionsbedingungen vom Substrat verdrängt werden können.

- Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, X in  
 45 bis zu 10fachem, insbesondere bis zu 3fachem Überschuß bezogen auf I einzusetzen.



Die für die Herstellung der Verbindungen I benötigten Ausgangsstoffe der Formel II können nach literaturbekannten Methoden beispielsweise auf folgender Syntheseroute erhalten werden:

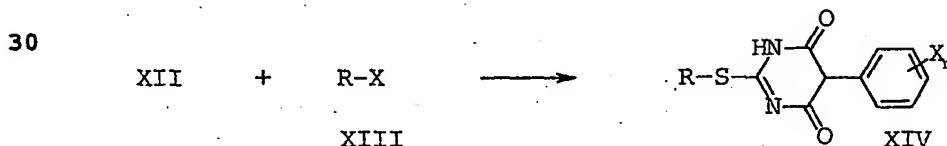
- 5 Ausgehend von Phenylmalonsäurealkylestern der Formel XI und Thioharnstoff werden Verbindungen der Formel XII erhalten,



- wobei in Formel XI R für C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl steht. Die Reaktion erfolgt üblicherweise in einem protischen Lösungsmittel wie z.B. Alkoholen, insbesondere Ethanol, gegebenenfalls in Gegenwart einer
- 15 Base, wie Na<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> und NaHCO<sub>3</sub>. Die Reaktionstemperatur liegt vorzugsweise bei 70-220°C [vgl. Collect. Czech. Chem. Commun., Bd. 48, S. 137-143 (1983); Heteroat. Chem., Bd. 10, S. 17-23 (1999); Czech. Chem. Commun., Bd. 58, S. 2215-2221 (1993)].

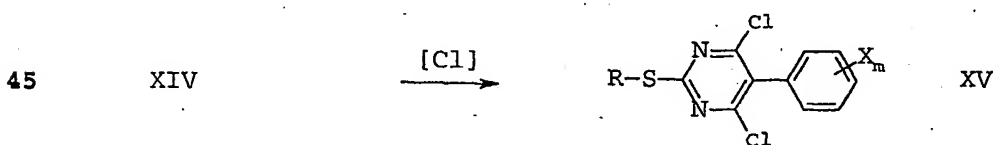
- 20 Die benötigten Phenylmalonsäureester XI sind aus EP-A 10 02 788 bekannt.

- Verbindungen XII werden durch Alkylierungsmittel XIII zu Thiobarbitursäurederivaten umgesetzt. In Formel XIII bedeutet R C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Al-
- 25 kyl und X eine nucleophil abspaltbare Abgangsgruppe. Formel XIII steht allgemein für übliche Alkylierungsmittel, wie Methylchlorid und Methylbromid, Dimethylsulfat oder Methansulfonsäuremethylester.



- Die Reaktion kann in Wasser oder auch einem dipolar aprotischen
- 35 Lösungsmittel wie z.B. N,N-Dimethylformamid durchgeführt werden [vgl. US 5,250,689], sie erfolgt vorteilhaft in Gegenwart einer Base, wie beispielsweise KOH, NaOH, NaHCO<sub>3</sub> und Na<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> oder Pyridin. Die Reaktionstemperatur liegt vorzugsweise bei 10-60°C.

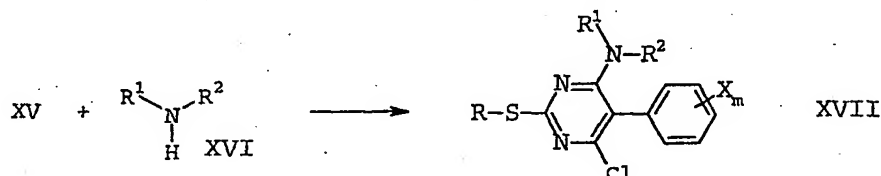
- 40 Verbindungen XIV werden in Dichlorpyrimidine der Formel XV überführt [vgl. EP-A 745 593; WO-A 99/32458; J.Org. Chem. Bd. 58, S. 3785-3786 (1993)].



Als Chlorierungsmittel [Cl] eignen sich beispielsweise  $\text{POCl}_3$ ,  $\text{PCl}_3/\text{Cl}_2$  oder  $\text{PCl}_5$ . Die Reaktion kann in überschüssigem Chlorierungsmittel ( $\text{POCl}_3$ ) oder einem inerten Lösungsmittel durchgeführt werden. Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise zwischen 10 und 180°C.

Durch Aminierung mit XVI werden die Dichlorverbindungen der Formel XV in die Verbindungen der Formel XVII überführt.

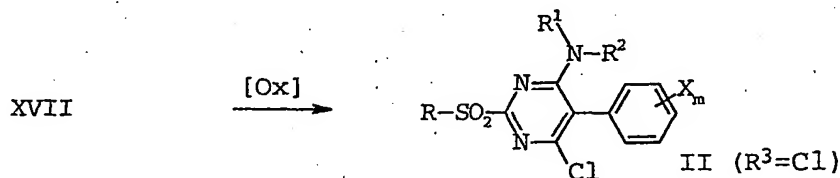
10



- 15 Diese Umsetzung erfolgt vorzugsweise bei 20 bis 120°C [vgl. J. Chem. Res. S (7), S. 286-287 (1995); Liebigs Ann. Chem., S. 1703-1705 (1995)] in einem inerten Lösungsmittel gegebenenfalls in Gegenwart einer Hilfsbase, wie  $\text{NaHCO}_3$ ,  $\text{Na}_2\text{CO}_3$  oder tert. Amine.
- 20 Die Amine der Formel XVI sind käuflich oder literaturbekannt oder können nach bekannten Methoden hergestellt werden.

Die Thioverbindungen XVII werden zu den Sulfonen der Formel II oxidiert.

25



30

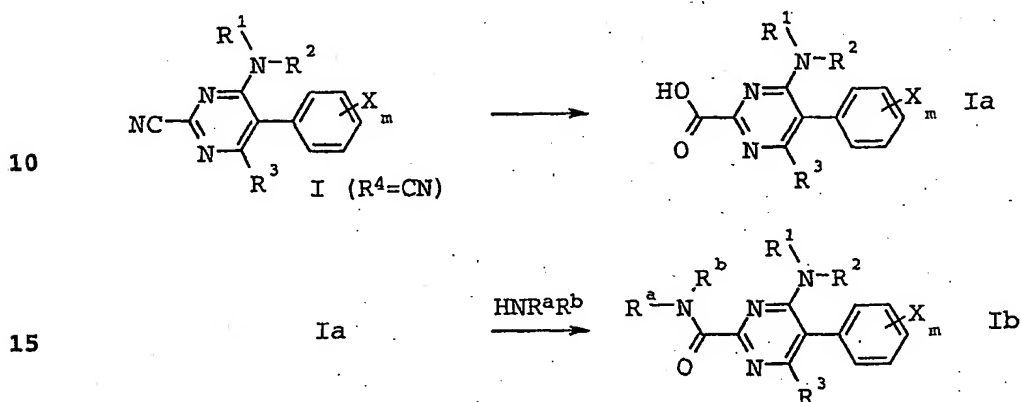
- Die Reaktion wird vorzugsweise bei 10 bis 50°C in Gegenwart protischer oder aprotischer Lösungsmittel durchgeführt [vgl.: B. Kor. Chem. Soc., Bd. 16, S. 489-492 (1995); Z. Chem., Bd. 17, S. 63 (1977)]. Geeignete Oxidationsmittel sind beispielsweise Wasserstoffperoxid oder 3-Chlorperbenzoesäure.

Die Einführung von von Chlor verschiedenen Gruppen  $\text{R}^3$  in die Sulfone II kann analog der Verbindungen der Formel I erfolgen.

- 40 Verbindungen der Formel I, in der  $\text{R}^4$  für  $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^c$ ,  $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^b$ ,  $-\text{C}(=\text{NOR}^c)\text{NR}^a\text{R}^b$ ,  $-\text{C}(=\text{NNR}^a\text{R}^b)\text{R}^c$  oder  $-\text{C}(=\text{NOR}^a)\text{R}^c$  steht, werden vorteilhaft aus Verbindungen der Formel I, in der  $\text{R}^4$  Cyano bedeutet, erhalten.

- 45 Verbindungen der Formel I, in der  $\text{R}^4$  für  $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^b$  oder  $-\text{C}(=\text{NOR}^c)\text{NR}^a\text{R}^b$  steht, sind aus den entsprechenden Nitrilen ( $\text{R}^4=\text{Cyano}$ ) durch Verseifung zu den Carbonsäuren der Formel Ia

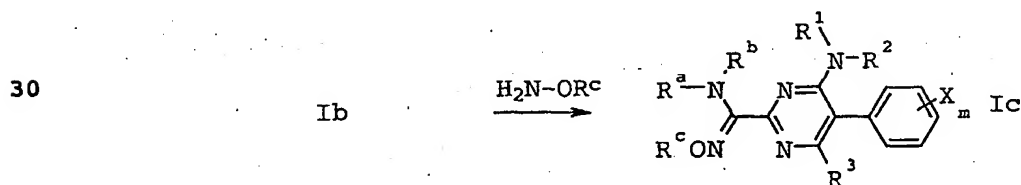
unter sauren oder basischen Bedingungen und Amidierung mit Aminen  $\text{HNR}^a\text{R}^b$ . Die Verseifung erfolgt üblicherweise in inerten polaren Lösungsmitteln, wie Wasser oder Alkoholen, bevorzugt mit anorganischen Basen, wie Alkali- oder Erdalkalimetallhydroxiden, insbesondere NaOH.



Diese Umsetzungen erfolgen vorteilhaft unter den aus Chem. and Pharm. Bull. 1982, Bd.30, N12, S.4314 bekannten Bedingungen.

20

Aus Amidn der Formel Ib werden durch Oximierung mit substituierten Hydroxyaminen  $\text{H}_2\text{N}-\text{OR}^c$  unter basischen Bedingungen die Verbindungen der Formel I, in der  $\text{R}^4$  für  $-\text{C}(=\text{NOR}^c)\text{NR}^a\text{R}^b$  steht, erhalten [vgl. US 4,876,252]. Die substituierten Hydroxyamine können als freie Base oder bevorzugt in Form Ihrer Säureadditionssalze eingesetzt werden. Aus praktischen Gründen kommen dabei insbesondere die Halogenide, wie die Chloride oder die Sulfate in Frage.

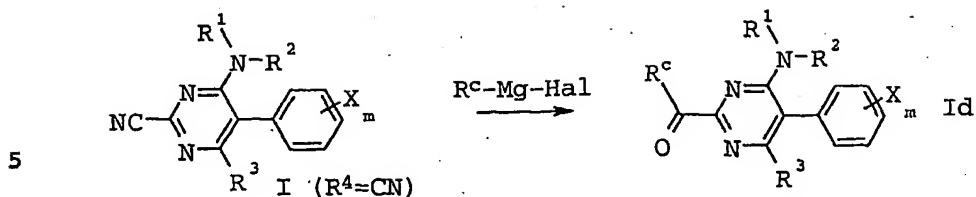


35 Alternativ können die Amidoxime der Formel Ic, in der  $\text{R}^a$  und  $\text{R}^b$  für Wasserstoff stehen, auch aus den entsprechenden Nitrilen ( $\text{R}^4=\text{Cyano}$ ) durch Umsetzung mit Hydroxylamin und anschließender Alkylierung erhalten werden. Diese Umsetzung erfolgt vorteilhaft unter den aus DE-A 198 37 794 bekannten Bedingungen.

40

Verbindungen der Formel I, in der  $\text{R}^4$  für  $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^c$  steht, sind aus den entsprechenden Nitrilen ( $\text{R}^4=\text{Cyano}$ ) durch Umsetzung mit Grignard-Verbindungen  $\text{R}^c-\text{Mg}-\text{Hal}$ , wobei Hal für ein Halogenatom, insbesondere für Chlor oder Brom steht, zugänglich.

45



Diese Umsetzung erfolgt vorteilhaft unter den aus J. Heterocycl. Chem. 1994, Bd.31(4), S.1041 bekannten Bedingungen.

10 Die Substituenten und Indices in Formeln Ia, Ib und Ic entsprechen denen in Formel I.

Verbindungen der Formel I, in der R<sup>4</sup> für -C(=NNR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>)R<sup>c</sup> steht, sind über die Carbonylverbindungen Id zugänglich. Sie werden durch Um-  
 15 setzung von Id mit Hydrazinen H<sub>2</sub>NNR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, bevorzugt unter den aus J. Org. Chem. 1966, Bd.31, S.677 bekannten Bedingungen erhalten.

Verbindungen der Formel I, in der R<sup>4</sup> für -C(=NOR<sup>a</sup>)R<sup>c</sup> steht, sind über Oximierung von Carbonylverbindungen Id zugänglich. Die Oxi-  
 20 mierung von Id erfolgt analog der Oximierung der Verbindungen Ib.

Die Reaktionsgemische werden in üblicher Weise aufgearbeitet, z.B. durch Mischen mit Wasser, Trennung der Phasen und gegebenenfalls chromatographische Reinigung der Rohprodukte. Die Zwischen-  
 25 und Endprodukte fallen z.T. in Form farbloser oder schwach bräunlicher, zäher Öle an, die unter vermindertem Druck und bei mäßig erhöhter Temperatur von flüchtigen Anteilen befreit oder gereinigt werden. Sofern die Zwischen- und Endprodukte als Feststoffe erhalten werden, kann die Reinigung auch durch Umkristallisieren  
 30 oder Digerieren erfolgen.

Sofern einzelne Verbindungen I nicht auf den voranstehend beschriebenen Wegen zugänglich sind, können sie durch Derivatisierung anderer Verbindungen I hergestellt werden.

35

Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Symbole wurden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die folgenden Substituenten stehen:

40 **Halogen:** Fluor, Chlor, Brom und Jod;

**Alkyl:** gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4 oder 6 Kohlenstoffatomen, z.B. C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl,  
 45 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl,

2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methyl-  
5 propyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl;

**Halogenalkyl:** geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch  
10 Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können, z.B. C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Di-  
15 fluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl und Pentafluorethyl;

**Alkoxy:** geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis  
20 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über ein Sauerstoffatom (-O-) an das Gerüst gebunden sind;

**Alkylthio:** geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 10  
oder 1 bis 4 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche  
25 über ein Schwefelatom (-S-) an das Gerüst gebunden sind;

**Alkenyl:** ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position, z.B. C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl wie  
30 Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl,  
35 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl,  
40 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-bute-  
45 nyl, 1,2-Dimethyl-1-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl, 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-1-

## 12

- butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 3,3-Dimethyl-1-butenyl, 3,3-Dimethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-1-butenyl, 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-1-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 5 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1propenyl und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;

**Halogenalkenyl:** ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 8 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position (wie vorstehend genannt), 10 wobei in diesen Gruppen die Wasserstoffatome teilweise oder vollständig gegen Halogenatome wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor, Chlor und Brom, ersetzt sein können;

- 15 **Alkinyl:** geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 2 bis 4, 6 oder 8 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen Position, z.B. C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl wie Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 20 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-1-pentinyl, 25 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;

- 30 **Halogenalkinyl:** ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 8 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen Position (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen die Wasserstoffatome teilweise 35 oder vollständig gegen Halogenatome wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor, Chlor und Brom, ersetzt sein können;

- Alkinyloxy:** ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 3 bis 8 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen, nicht zum Heteroatom benachbarten, 40 Position (wie vorstehend genannt), welche über ein Sauerstoffatom (-O-) an das Gerüst gebunden sind;

## 13

**Cycloalkyl:** monocyclische, gesättigte Kohlenwasserstoffgruppen mit 3 bis 6, 8 oder 10 Kohlenstoffringgliedern, z.B. C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl und Cyclooctyl;

5

- 5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl enthaltend neben Kohlenstoffringgliedern ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein oder zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatom, z.B. 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl, 3-Isloxazolidinyl, 4-Isloxazolidinyl, 5-Isloxazolidinyl, 3-Isothiazolidinyl, 4-Isothiazolidinyl, 5-Isothiazolidinyl, 3-Pyrazolidinyl, 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl, 5-Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazolidinyl, 1,2,4-Oxadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Oxadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Triazolidin-3-yl, 1,3,4-Oxadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Thiadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Triazolidin-2-yl, 2,3-Dihydrofur-2-yl, 2,3-Dihydrofur-3-yl, 2,4-Dihydrofur-2-yl, 2,4-Dihydrofur-3-yl, 2,3-Dihydrothien-2-yl, 2,3-Dihydrothien-3-yl, 2,4-Dihydrothien-2-yl, 2,4-Dihydrothien-3-yl, 2-Pyrrolin-2-yl, 2-Pyrrolin-3-yl, 3-Pyrrolin-2-yl, 3-Pyrrolin-3-yl, 2-Isloxazolin-3-yl, 3-Isloxazolin-3-yl, 4-Isloxazolin-3-yl, 2-Isloxazolin-4-yl, 3-Isloxazolin-4-yl, 4-Isloxazolin-4-yl, 2-Isloxazolin-5-yl, 3-Isloxazolin-5-yl, 4-Isloxazolin-5-yl, 2-Isouthiazolin-3-yl, 3-Isouthiazolin-3-yl, 4-Isouthiazolin-3-yl, 2-Isouthiazolin-4-yl, 3-Isouthiazolin-4-yl, 4-Isouthiazolin-4-yl, 2-Isouthiazolin-5-yl, 3-Isouthiazolin-5-yl, 4-Isouthiazolin-5-yl, 2,3-Dihydropyrazol-1-yl, 2,3-Dihydropyrazol-2-yl, 2,3-Dihydropyrazol-3-yl, 2,3-Dihydropyrazol-4-yl, 2,3-Dihydropyrazol-5-yl, 3,4-Dihydropyrazol-1-yl, 3,4-Dihydropyrazol-3-yl, 3,4-Dihydropyrazol-4-yl, 3,4-Dihydropyrazol-5-yl, 4,5-Dihydropyrazol-1-yl, 4,5-Dihydropyrazol-3-yl, 4,5-Dihydropyrazol-4-yl, 4,5-Dihydropyrazol-5-yl, 2,3-Dihydrooxazol-2-yl, 2,3-Dihydrooxazol-3-yl, 2,3-Dihydrooxazol-4-yl, 2,3-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 3,4-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 2-Piperidinyl, 3-Piperidinyl, 4-Piperidinyl, 1,3-Dioxan-5-yl, 2-Tetrahydropyranyl, 4-Tetrahydropyranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Hexahydropyridazinyl, 4-Hexahydropyridazinyl, 2-Hexahydropyrimidinyl, 4-Hexahydropyrimidinyl, 5-Hexahydropyrimidinyl, 2-Piperazinyl, 1,3,5-Hexahydro-triazin-2-yl und 1,2,4-Hexahydrotriazin-3-yl;

45

5- oder 6-gliederiges Heteroaryl, welches neben Kohlenstoffringgliedern Heteroatome aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff enthalten kann: Aryl wie vorstehend genannt oder ein- oder zweikerniges Heteroaryl, z.B.

- 5 - 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom: 5-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Isoxazolyl, 4-Isoxazolyl, 5-Isoxazolyl, 3-Isotiazolyl, 4-Isotiazolyl, 5-Isotiazolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl,
- 10 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,2,4-Triazol-3-yl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl, 1,3,4-Thiadiazol-2-yl und 1,3,4-Triazol-2-yl;
- 15 - benzokondensiertes 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome oder ein Stickstoffatom und ein Sauerstoff- oder Schwefelatom: 5-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder enthalten können, und in welchen zwei benachbarte Kohlenstoffringglieder oder ein Stickstoff- und ein benachbartes Kohlenstoffringglied durch eine Buta-1,3-dien-1,4-diylgruppe verbrückt sein können;
- 20 - 6-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome: 6-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl und 1,2,4-Triazin-3-yl;
- 30

35

**Alkylen:** divalente unverzweigte Ketten aus 1 bis 4 CH<sub>2</sub>-Gruppen, z.B. CH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub> und CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>;

- Oxyalkylen:** divalente unverzweigte Ketten aus 2 bis 4 CH<sub>2</sub>-Gruppen, wobei eine Valenz über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z.B. OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub> und OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>;
- 40

**Oxyalkylenoxy:** divalente unverzweigte Ketten aus 1 bis 3 CH<sub>2</sub>-Gruppen, wobei beide Valenzen über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z.B. OCH<sub>2</sub>O, OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O und OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O;

45



## 15

**Alkenylen:** divalente unverzweigte Ketten aus 1 bis 3 CH<sub>2</sub>-Gruppen und einer CH=CH-Gruppe in einer beliebigen Position, z.B. CH=CHCH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH=CHCH<sub>2</sub>, CH=CHCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>CH=CHCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub> und CH=CHCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>;

5

Im Hinblick auf ihre bestimmungsgemäße Verwendung der Phenylpyrimidine der Formel I sind die folgenden Bedeutungen der Substituenten, und zwar jeweils für sich allein oder in Kombination, besonders bevorzugt:

10

Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> für Wasserstoff steht.

Gleichermaßen besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> unabhängig voneinander C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl bedeuten.

15

Insbesondere werden Verbindungen der Formel I bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl und R<sup>2</sup> für Wasserstoff steht.

20

Besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> gemeinsam mit dem überbrückenden Stickstoffatom einen gesättigten oder ungesättigten fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch eine Ether- (-O-), Thio- (-S-), Sulfoxyl- (-S[=O]-) oder Sulfonylgruppe (-SO<sub>2</sub>-) unterbrochen sein und/oder der durch eine oder zwei Methyl- oder Halogenmethylgruppen substituiert sein kann oder in dem zwei benachbarte Kohlenstoffatome durch eine Methylengruppe verbrückt sind. Die Substitution durch eine oder zwei Methyl- oder Halogenmethylgruppen, insbesondere eine oder zwei Methylgruppen ist besonders bevorzugt.

25

30

Außerdem werden Verbindungen der Formel I bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> gemeinsam eine Butylen-, Pentylen- oder eine Pentenylenkette bilden, die durch eine Alkyl-, insbesondere eine Methylgruppe substituiert, oder in den zwei benachbarte Kohlenstoffatome durch eine Methylengruppe verbrückt sein können.

35

Ferner werden Verbindungen der Formel I bevorzugt, in denen R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> gemeinsam eine Pentylen- oder eine Pentenylenkette bilden, die durch eine Methylgruppe substituiert ist.

40

Besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> gemeinsam mit dem überbrückenden Stickstoffatom eine 3- oder 4-Methylpiperidinyldingruppe oder eine 2-Methylpyrrolidingruppe bilden.

45

Daneben werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen  $R^3$  für Halogen, insbesondere für Chlor steht.

Gleichermaßen besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen  $R^4$   
5 Wasserstoff, Cyano, Azido,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_8$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_8$ -Alkinyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $-ON=CR^aR^b$  oder  $-NR^cN=CR^aR^b$  oder  $-C(=NOR^c)NR^aR^b$  bedeutet.

Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen  $R^4$  für  
10 Cyano,  $-CR^aNOR^b$  oder  $-ON=CR^aR^b$ , insbesondere für  $-ON=CR^aR^b$  steht.

Daneben werden Verbindungen I bevorzugt, in denen  $R^4$  für  
 $-NH(=NH)NHR^c$ ,  $-NHC(=O)NHR^a$ ,  $-NHC(=O)R^a$ ,  $-OC(=O)R^a$ ,  $-C(=NOR^c)NH_2$   
oder  $-CR^c(=NNR^aR^b)$  steht.

15

Weiterhin werden Verbindungen I bevorzugt, in denen  $R^4$  für  
 $-NR^cN=CR^aR^b$  steht.

Gleichermaßen bevorzugt sind Verbindungen I, in denen  $R^4$  für  
20  $-C(=NOR^c)NR^aR^b$ , insbesondere für  $-C(=NOR^c)NH_2$  steht.

Daneben werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen  $R^4$  für  
 $C_1$ - $C_6$ -Alkenyl oder Azido steht.

25 Außerdem werden Verbindungen I bevorzugt, in denen  $R^a$  und  $R^b$   
gleich oder verschieden sind und Wasserstoff,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  
 $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy, Phenyl oder einen fünf- oder sechsgliedrigen aromatischen Heterocyclus bedeuten, wobei die Ringe ggf. durch eine  
bis drei Gruppen  $R^x$  substituiert sein können; die Bedeutungen Was-  
30 serstoff, Alkyl, Alkoxy und ggf. substituiertes Phenyl sind von  
diesen besonders bevorzugt.

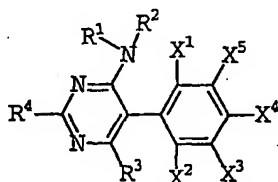
Besonders bevorzugte Ausgestaltungen für die Reste  $R^a$  und  $R^b$  sind  
 $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_2$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy- $C_1$ - $C_2$ -alkyl,  $C_3$ - $C_6$ -Al-  
35 keryl,  $C_3$ - $C_6$ -Halogenalkenyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ -Halogenalkoxy, Pyri-  
dyl, Pyrazolyl, Phenyl oder Benzyl, oder  $R^a$  und  $R^b$  bilden gemein-  
sam eine Butylen- oder Pentylenkette, wobei die cyclischen Grup-  
pen durch bis zu vier Substituenten aus Halogen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  
 $C_1$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy und/oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy- $C_1$ - $C_2$ -alkyl  
40 substituiert sein können.

Eine bevorzugte Ausgestaltung für  $R^c$  ist Wasserstoff.

Gleichermaßen bevorzugt sind Verbindungen I, in denen X für  
45 Chlor, Fluor, Methyl, Trifluormethyl oder Methoxy steht.

Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen ein oder zwei Substituenten X orthoständig zu der Verknüpfungsstelle mit dem Pyrimidinring stehen.

5 Daneben werden Verbindungen IA besonders bevorzugt,



IA

10

in denen R<sup>1</sup> bis R<sup>4</sup> wie für Formel I definiert sind und X<sup>1</sup> bis X<sup>5</sup> gleich oder verschieden sind und

- 15 X<sup>1</sup> Fluor, Chlor, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Älkoxy; und  
 X<sup>2</sup>, X<sup>3</sup>, X<sup>4</sup>, X<sup>5</sup> Wasserstoff oder eine der bei X<sup>1</sup> und X<sup>2</sup> genannten Gruppen bedeuten.

- Insbesondere werden Verbindungen IA bevorzugt, in denen  
 20 X<sup>1</sup>, X<sup>2</sup> Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl oder Methoxy;  
 X<sup>3</sup>, X<sup>4</sup>, X<sup>5</sup> Wasserstoff oder eine der bei X<sup>1</sup> und X<sup>2</sup> genannten Gruppen bedeuten.

- Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen X<sub>m</sub>  
 25 für F<sub>5</sub>, 2-Cl, 2-F, 2-CH<sub>3</sub>, 2-OCH<sub>3</sub>, 2,6-Cl<sub>2</sub>, 2,6-F<sub>2</sub>, 2-Cl-6-F,  
 2-Br-6-F, 2-CH<sub>3</sub>-4-Cl, 2-CH<sub>3</sub>-4-F, 2-CH<sub>3</sub>-5-F, 2-CH<sub>3</sub>-6-F,  
 2-CH<sub>3</sub>-4-OCH<sub>3</sub>, 2-CF<sub>3</sub>-4-F, 2-CF<sub>3</sub>-5-F, 2-CF<sub>3</sub>-6-F, 2-CF<sub>3</sub>-4-OCH<sub>3</sub>,  
 2-OCH<sub>3</sub>-6-F, 2,4,6-Cl<sub>3</sub>, 2,3,6-F<sub>3</sub>, 2,4,6-F<sub>3</sub>, 2,4,6-(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>,  
 2,6-F<sub>2</sub>-4-CH<sub>3</sub>, 2,6-F<sub>2</sub>-4-OCH<sub>3</sub>, 2,4-F<sub>2</sub>-6-OCH<sub>3</sub>, 2,6-(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-4-OCH<sub>3</sub> und  
 30 2,6-(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-4-F steht.

- Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen X<sub>m</sub> für F<sub>5</sub>,  
 2,6-Cl<sub>2</sub>, 2,6-F<sub>2</sub>, 2-Cl-6-F, 2-CH<sub>3</sub>-4-F, 2-CH<sub>3</sub>-6-F, 2-CH<sub>3</sub>-4-Cl und  
 2,4,6-F<sub>3</sub> steht.

35

- Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich  
 durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum  
 von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus der Klasse der  
*Ascomyceten*, *Deuteromyceten*, *Phycomyceten* und *Basidiomyceten*,  
 40 aus. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzen-  
 schutz als Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.

- Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl  
 von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen,  
 45 Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Bananen, Baumwolle, Soja, Kaf-  
 fee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüsepflanzen

wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

- *Alternaria*-Arten, *Podosphaera*-Arten, *Sclerotinia*-Arten, *Phylospora canker* an Gemüse und Obst,
- *Botrytis cinerea* (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,
- 10 • *Corynespora cassiicola* an Gurken,
- *Colletotrichum*-Arten an Obst und Gemüse,
- *Diplocarpon rosae* an Rosen,
- *Elsinoe fawcetti* und *Diaporthe citri* an Citrus-Früchten,
- *Sphaerotheca*-Arten an Kürbisgewächsen, Erdbeeren und Rosen,
- 15 • *Cercospora*-Arten an Erdnüssen, Zuckerrüben und Auberginen,
- *Erysiphe cichoracearum* an Kürbisgewächsen,
- *Leveillula taurica* an Paprika, Tomaten und Auberginen,
- *Mycosphaerella*-Arten an Äpfeln und japanischer Aprikose,
- *Phyllactinia kakicola*, *Gloesporium kaki*, an japanischer Aprikose,
- 20 • *Gymnosporangium yamadae*, *Leptothyrium pomi*, *Podosphaera leucotricha* und *Gloedes pomigena* an Äpfeln,
- *Cladosporium carpophilum* an Birnen und japanischer Aprikose,
- *Phomopsis*-Arten an Birnen,
- 25 • *Phytophthora*-Arten an Citrusfrüchten, Kartoffeln, Zwiebeln, insbesondere *Phytophthora infestans* an Kartoffeln und Tomaten,
- *Blumeria graminis* (echter Mehltau) an Getreide,
- *Fusarium*- und *Verticillium*-Arten an verschiedenen Pflanzen,
- *Glomerella cingulata* an Tee,
- 30 • *Drechslera*- und *Bipolaris*-Arten an Getreide und Reis,
- *Mycosphaerella*-Arten an Bananen und Erdnüssen,
- *Plasmopara viticola* an Reben,
- *Personospora*-Arten an Zwiebeln, Spinat und Chrysantemen,
- *Phaeoisariopsis vitis* und *Sphaceloma ampelina* an Grapefruits,
- 35 • *Pseudocercospora herpotrichoides* an Weizen und Gerste,
- *Pseudoperonospora*-Arten an Hopfen und Gurken,
- *Puccinia*-Arten und *Typhula*-Arten an Getreide und Rasen,
- *Pyricularia oryzae* an Reis,
- *Rhizoctonia*-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,
- 40 • *Stagonospora nodorum* und *Septoria tritici* an Weizen,
- *Uncinula necator* an Reben,
- *Ustilago*-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie
- *Venturia*-Arten (Schorff) an Äpfeln und Birnen.

Die Verbindungen I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schädlingen wie *Paecilomyces variotii* im Materialschutz (z.B. Holz, Papier, Dispersionen für den Anstrich, Fasern bzw. Gewebe) und im Vorratsschutz.

5

Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid wirksamen Menge der Wirkstoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch nach der

10 Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.

Die fungiziden Mittel enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 Gew.-% Wirkstoff.

15

Die Aufwandmengen liegen bei der Anwendung im Pflanzenschutz je nach Art des gewünschten Effektes zwischen 0,01 und 2,0 kg Wirkstoff pro ha.

20 Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 0,001 bis 0,1 g, vorzugsweise 0,01 bis 0,05 g je Kilogramm Saatgut benötigt.

Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich  
25 die Aufwandmenge an Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effektes. Übliche Aufwandmengen sind im Materialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise 0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Kubikmeter behandelten Materials.

30 Die Verbindungen I können in die üblichen Formulierungen überführt werden, z.B. Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die Anwendungsform richtet sich nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie soll in jedem Fall eine  
35 feine und gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Verbindung gewährleisten.

Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstrecken des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgier-

40 mitteln und Dispergiermitteln, wobei im Falle von Wasser als Verdünnungsmittel auch andere organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden können. Als Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht: Lösungsmittel wie Aromaten (z.B. Xylol), chlorierte Aromaten (z.B. Chlorbenzole), Paraffine (z.B. Erdölfraktionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol), Ketone (z.B. Cyclohexanon), Amine (z.B. Ethanolamin, Dimethylformamid) und Wasser; Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline,

Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nicht-ionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiermittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate und Fettsäuren sowie deren Alkali- und Erdalkalisalze, Salze von sulfatiertem Fettalkoholglykoether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykoether, Tributylphenylpolyglykoether, Alkylarylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoetheracetal, Sorbitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Benzol, Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Chlorbenzol, Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z.B. Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, Wasser, in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineralerden, wie Silicagel, Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produk-

te, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% des Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

Beispiele für Formulierungen sind:

10

I. 5 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 95 Gew.-Teilen feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 5 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

15

II. 30 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit einer Mischung aus 92 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel und 8 Gew.-Teilen Paraffinöl, das auf die Oberfläche dieses Kieselsäuregels gesprüht wurde, innig vermischt. Man erhält auf diese Weise eine Aufbereitung des Wirkstoffs mit guter Haftfähigkeit (Wirkstoffgehalt 23 Gew.-%).

20

III. 10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 90 Gew.-Teilen Xylol, 6 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 2 Gew.-Teilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 2 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 9 Gew.-%).

25

30

IV. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 60 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 16 Gew.-%).

35

V. 80 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutyl-naphthalin-alpha-sulfonsäure, 10 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 7 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen (Wirkstoffgehalt 80 Gew.-%).

40

45

- 5 VI. Man vermischt 90 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung mit 10 Gew.-Teilen N-Methyl- $\alpha$ -pyrrolidon und erhält eine Lösung, die zur Anwendung in Form kleinster Tropfen geeignet ist (Wirkstoffgehalt 90 Gew.-%).
- 10 VII. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 20 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- 15 VIII. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutyl-naphthalin- $\alpha$ -sulfonsäure, 17 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Lignin-sulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20 000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- 20
- 25 Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.
- 30
- 35 Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereitete werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-,
- 40 Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.
- 45



Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und 10%, vorzugsweise zwischen 0,01 und 1%.

5

Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-% Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff ohne Zusätze auszubringen.

10

Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Herbizide, Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zugesetzt werden. Diese Mittel können zu den erfindungsgemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugemischt werden.

15

Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zusammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, der z.B. mit Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren, Fungiziden oder auch mit Düngemitteln. Beim Vermischen der Verbindungen I bzw. der sie enthaltenden Mittel in der Anwendungsform als Fungizide mit anderen Fungiziden erhält man in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums.

25 Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen gemeinsam angewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken:

- Schwefel, Dithiocarbamate und deren Derivate, wie Ferridimethyldithiocarbamat, Zinkdimethyldithiocarbamat, Zinkethylenbisdithiocarbamat, Manganethylenbisdithiocarbamat, Mangan-Zinkethylen-diamin-bis-dithiocarbamat, Tetramethylthiuramdisulfide, Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N'-ethylen-bis-dithiocarbamat), Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N'-propylen-bis-dithiocarbamat), Zink-(N,N'-propylenbis-dithiocarbamat), N,N'-Polypropylenbis-(thiocarbamoyl)disulfid;
- Nitroderivate, wie Dinitro-(1-methylheptyl)-phenylcrotonat, 2-sec-Butyl-4,6-dinitrophenyl-3,3-dimethylacrylat, 2-sec-Butyl-4,6-dinitrophenyl-isopropylcarbonat, 5-Nitro-isophthalsäure-di-isopropylester;
- heterocyclische Substanzen, wie 2-Heptadecyl-2-imidazolin-acetat, 2-Chlor-N-(4'-chlor-biphenyl-2-yl)-nicotinamid, 2,4-Dichlor-6-(o-chloranilino)-s-triazin, O,O-Diethyl-phthalimido-phosphonothioat, 5-Amino-1-[bis-(dimethylamino)-phosphinyl]-3-phenyl-1,2,4-triazol, 2,3-Dicyano-1,4-dithioanthrachinon, 2-Thio-1,3-dithiolo[4,5-b]chinoxalin, 1-(Butylcarbamoyl)-2-benzimidazol-carbaminsäuremethylester, 2-Methoxycarbonyl-amino-benzimidazol, 2-(Furyl-(2))-benzimidazol, 2-(Thiazol-

- yl-(4))-benzimidazol, N-(1,1,2,2-Tetrachlorethylthio)-tetrahydrophthalimid, N-Trichlormethylthio-tetrahydrophthalimid, N-Trichlormethylthio-phthalimid,
- N-Dichlorfluormethylthio-N',N'-dimethyl-N-phenyl-schwefelsäurediamid, 5-Ethoxy-3-trichlormethyl-1,2,3-thiadiazol, 2-Rhodamethylthiobenzthiazol, 1,4-Dichlor-2,5-dimethoxybenzol, 4-(2-Chlorphenylhydrazono)-3-methyl-5-isoxazon, Pyridin-2-thio-1-oxid, 8-Hydroxychinolin bzw. dessen Kupfersalz, 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin, 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin-4,4-dioxid, 2-Methyl-5,6-dihydro-4H-pyran-3-carbonsäure-anilid, 2-Methylfuran-3-carbonsäureanilid, 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,4,5-Trimethyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäurecyclohexylamid, N-Cyclohexyl-N-methoxy-2,5-dimethyl-furan-3-carbonsäureamid, 2-Methyl-benzoesäureanilid, 2-Iod-benzoesäure-anilid, N-Formyl-N-morpholin-2,2,2-trichlorethylacetal, Piperazin-1,4-diylbis-1-(2,2,2-trichlorethyl)-formamid, 1-(3,4-Dichloranilino)-1-formylamino-2,2,2-trichlorethan, 2,6-Dimethyl-N-tridecyl-morpholin bzw. dessen Salze, 2,6-Dimethyl-N-cyclododecyl-morpholin bzw. dessen Salze, N-[3-(p-tert.-Butylphenyl)-2-methylpropyl]-cis-2,6-dimethyl-morpholin, N-[3-(p-tert.-Butylphenyl)-2-methylpropyl]-piperidin, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-4-ethyl-1,3-dioxolan-2-yl-ethyl]-1H-1,2,4-triazol, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-4-n-propyl-1,3-dioxolan-2-yl-methyl]-1H-1,2,4-triazol, N-(n-Propyl)-N-(2,4,6-trichlorphenoxyethyl)-N'-imidazol-yl-harnstoff, 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanon, 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanol, (2RS,3RS)-1-[3-(2-Chlorphenyl)-2-(4-fluorphenyl)-oxiran-2-ylmethyl]-1H-1,2,4-triazol,  $\alpha$ -(2-Chlorphenyl)- $\alpha$ -(4-chlorphenyl)-5-pyrimidin-methanol, 5-Butyl-2-dimethylamino-4-hydroxy-6-methyl-pyrimidin, Bis-(p-chlorphenyl)-3-pyridinmethanol, 1,2-Bis-(3-ethoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol, 1,2-Bis-(3-methoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol,
  - Strobilurine wie methyl (E)-2-{2-[6-(2-cyanophenoxy)pyrimidin-4-yloxy]phenyl}-3-methoxyacrylate, (E)-2-(methoxyimino)-N-methyl-2-[ $\alpha$ -(2,5-xylyloxy)-o-tolyl]acetamide, {2-[6-(2-chlorophenoxy)-5-fluoropyrimidin-4-yloxy]phenyl}(5,6-dihydro-1,4,2-dioxazin-3-yl)methanone O-methyloxime, methyl (E)-methoxyimino[ $\alpha$ -(o-tolyloxy)-o-tolyl]acetate, (E)-2-(methoxyimino)-N-methyl-2-(2-phenoxyphenyl)acetamide, (2E)-2-(methoxyimino)-2-{2-[(3E,5E,6E)-5-(methoxyimino)-4,6-dimethyl-2,8-dioxa-3,7-diazanona-3,6-dien-1-yl]phenyl}-N-methylacetamide, methyl-(E)-3-methoxy-2-{2-[6-(trifluoromethyl)-2-pyridyloxymethyl]phenyl}acrylate, methyl N-{2-[1-(4-chlorophe-

- nyl)-1H-pyrazol-3-yloxymethyl]phenyl}(N-methoxy)carbamate, methyl (E)-methoxyimino-{(E)- $\alpha$ -[1-( $\alpha,\alpha,\alpha$ -trifluoro-m-tolyl)ethylideneaminoxy]-o-tolyl}acetate,
- Anilinopyrimidine wie N-(4,6-Dimethylpyrimidin-2-yl)-anilin,
  - 5 N-[4-Methyl-6-(1-propinyl)-pyrimidin-2-yl]-anilin, N-[4-Methyl-6-cyclopropyl-pyrimidin-2-yl]-anilin,
  - Phenylpyrrole wie 4-(2,2-Difluor-1,3-benzodioxol-4-yl)-pyrrol-3-carbonitril,
  - Zimtsäureamide wie 3-(4-Chlorphenyl)-3-(3,4-dimethoxyphenyl)-acrylsäuremorpholid, 3-(4-Fluorphenyl)-3-(3,4-dimethoxyphenyl)-acrylsäuremorpholid,
  - 10 • sowie verschiedene Fungizide, wie Dodecylguanidinacetat, 1-(3-Brom-6-methoxy-2-methyl-phenyl)-1-(2,3,4-trimethoxy-6-methyl-phenyl)-methanon, 3-[3-(3,5-Dimethyl-2-oxycyclohexyl)-2-hydroxyethyl]-glutarimid, Hexachlorbenzol, DL-Methyl-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-N-furoyl(2)-alaninat, DL-N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-(2'-methoxyacetyl)-alanin-methylester, N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-chloracetyl-D,L-2-aminobutyrolacton, DL-N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-(phenylacetyl)-alanin-
  - 20 methylester, 5-Methyl-5-vinyl-3-(3,5-dichlorphenyl)-2,4-dioxo-1,3-oxazolidin, 3-(3,5-Dichlorphenyl)-5-methyl-5-methoxymethyl-1,3-oxazolidin-2,4-dion, 3-(3,5-Dichlorphenyl)-1-isopropylcarbamoylhydantoin, N-(3,5-Dichlorphenyl)-1,2-dimethylcyclopropan-1,2-dicarbonensäureimid, 2-Cyano-[N-(ethylaminocarbonyl)-2-methoximino]-acetamid, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-pentyl]-1H-1,2,4-triazol, 2,4-Difluor- $\alpha$ -(1H-1,2,4-triazolyl-1-methyl)-benzhydrylalkohol, N-(3-Chlor-2,6-dinitro-4-trifluormethyl-phenyl)-5-trifluormethyl-3-chlor-2-aminopyridin,
  - 25 1-((bis-(4-Fluorphenyl)-methylsilyl)-methyl)-1H-1,2,4-triazol,
  - 30 5-Chlor-2-cyano-4-p-tolyl-imidazol-1-sulfonsäuredimethylamid, 3,5-Dichlor-N-(3-chlor-1-ethyl-1-methyl-2-oxo-propyl)-4-methylbenzamid.

### Synthesebeispiele

35

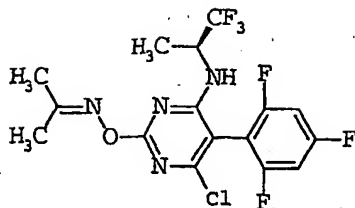
Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften wurden unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen I benutzt. Die so erhaltenen Verbindungen sind in der anschließenden Tabelle I

40 mit physikalischen Daten aufgeführt.

Beispiel 1: Herstellung von [6-Chlor-2-(N'-isopropylidene-hydrazino)-5-(2,4,6-trifluorphenyl)-pyrimidin-4-yl]-((S)-1-trifluormethyl-ethyl)-amin [I-1]

45

26

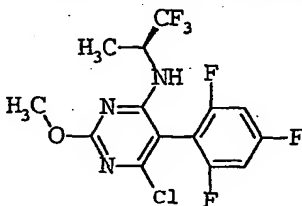


5

0,065 g (2,4 mmol) Natriumhydrid wurden in 10 ml Dimethylformamid (DMF) mit 0,16 g (2,2 mmol) Acetonoxim versetzt. Nach 1 Std. Rühren bei 20 bis 25°C wurde 1,0 g (2,2 mmol) [6-Chlor-2-methansulfonyl-5-(2,4,6-trifluor-phenyl)-pyrimidin-4-yl]-((S)-1-trifluormethyl-ethylamin (Abk. Sulfon 1) zugegeben. Nach weiteren 14 Std. Rühren bei 20 bis 25°C wurde die Mischung auf Wasser gegossen und mit Dichlormethan extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden mit Wasser gewaschen, dann getrocknet und schließlich vom Lösungsmittel befreit. Es bleiben 0,6 g der Titelverbindung vom Fp.: 157-159°C zurück.

Beispiel 2: Herstellung von [6-Chlor-2-methoxy-5-(2,4,6-trifluor-phenyl)-pyrimidin-4-yl]-((S)-1-trifluormethyl-ethyl)-amin [I-24]

20

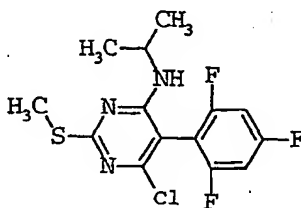


25

Eine Lösung von 282 mg (0,65 mmol) Sulfon 1 in 4 ml wasserfr. DMF wurde mit 294 mg (1,30 mmol) Natriummethylat (90%ig in Methanol) versetzt. Nach 16 Std. Rühren bei 20 bis 25°C wurde mit MTBE verdünnt, mit Wasser gewaschen, dann getrocknet. Nach Abdestillieren des Lösungsmittels und Chromatographie an Kieselgel wurden 0,14 g der Titelverbindung vom Fp. 121-129°C erhalten.

Beispiel 3: Herstellung von [6-Chlor-2-methylsulfonyl-5-(2,4,6-trifluor-phenyl)-pyrimidin-4-yl]-isopropylamin [I-30]

35



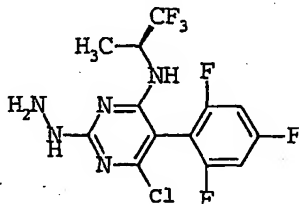
40

Eine Lösung von 216 mg (0,5 mmol) [6-Chlor-2-methansulfonyl-5-(2,4,6-trifluor-phenyl)-pyrimidin-4-yl]-isopropylamin (Abk. Sulfon 2) in 2 ml wasserfr. DMF wurde mit 70 mg (1,0 mmol) Natriumthiomethylat gelöst in 3 ml wasserfr. THF versetzt. Nach 16 Std. Rühren bei 20 bis 25°C wurde mit MTBE verdünnt, mit Wasser gewaschen, dann getrocknet. Nach Abdestillieren des Lösungsmittels

tels und Chromatographie an Kieselgel wurden 0,21 g der Titelverbindung vom Fp. 112-116°C erhalten.

Beispiel 4: Herstellung von [6-Chlor-2-hydrazino-5-(2,4,6-trifluorphenyl)-pyrimidin-4-yl]-((S)-1-trifluoromethyl-ethyl)-amin

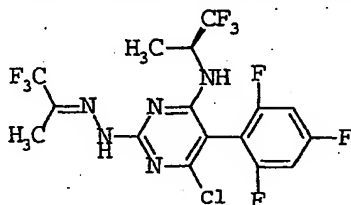
10



Eine ethanolische Lösung von 0,5 g (1,15 mmol) Sulfon 1 und 0,13 g (2,54 mmol) Hydrazinhydrat wurde 2 Std. bei 20 bis 25°C gerührt. Nach Abdestillieren des Lösungsmittels und Auskochen des Rückstandes in Diisopropylether wurde der Rückstand abfiltriert und mit Diisopropylether/Hexan 1:1 nachgewaschen.

Beispiel 5: Herstellung von [6-Chloro-2-[N'-(1-trifluormethyl-ethylidene)-hydrazino]-5-(2,4,6-trifluorphenyl)-pyrimidin-4-yl]-((S)-1-trifluoromethyl-ethyl)-amin [I-56]

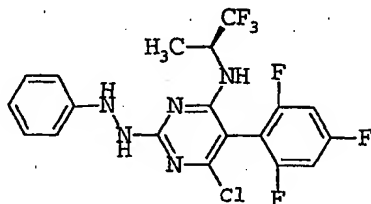
25



Eine Lösung von 0,8 g (2,07 mmol) des Hydrazids aus Bsp. 4 und 0,28 g (2,49 mmol) 1,1,1-Trifluoraceton in Acetonitril wurde 16 Std. bei 20 bis 25°C gerührt. Der Niederschlag wurde abfiltriert; aus dem Filtrat erhielt man nach Chromatographie an Kieselgel (CH:MTBE 95:5) 0,3 g der Titelverbindung vom Fp. 205-207 °C.

Beispiel 6: Herstellung von [6-Chlor-2-(N-phenyl-hydrazino)-5-(2,4,6-trifluorphenyl)-pyrimidin-4-yl]-((S)-1-trifluormethyl-ethyl)-amin [I-62]

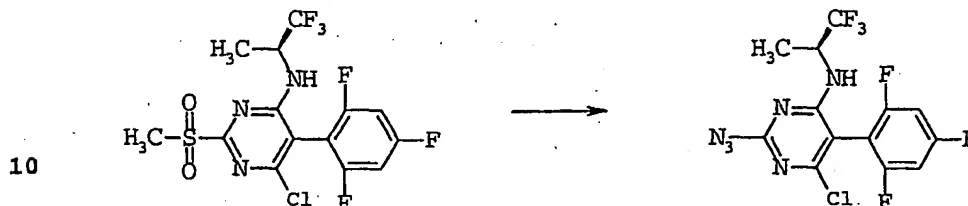
40



Eine ethanolische Lösung von 0,5 g (1,15 mmol) Sulfon 1 und 0,15 g (1,38 mmol) Phenylhydrazin wurde 14 Std. refluxiert. Nach Abkühlen und Abdestillieren des Lösungsmittels und Chromatogra-

phie an Kieselgel (Cyclohexan:Methyl-tert.butylether [MTBE] 95:5) wurden 0,36 g der Titelverbindung erhalten.

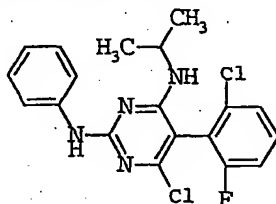
Beispiel 7: Herstellung von [2-Azido-6-chlor-5-(2,4,6-trifluor-phenyl)-pyrimidin-4-yl]-((S)-1-trifluoromethyl-ethyl)-amin [I-66]



Eine Lösung von 0,5 g (1,15 mmol) Sulfon 1 und 0,11 g (1,62 mmol) Natriumazid in Acetonitril wurde 2 Std. refluxiert. Nach Abkühlen und Abdestillieren des Lösungsmittels und Digerieren des Rück-  
 15 standes in Wasser wurden 0,33 g der Titelverbindung vom Fp. 152-154°C erhalten.

Beispiel 8: Herstellung von 6-Chloro-5-(2-chloro-6-fluor-phenyl)-N<sup>1</sup>-isopropyl-N<sup>2</sup>-phenylpyrimidin-2,4-diamin [I-69]

20

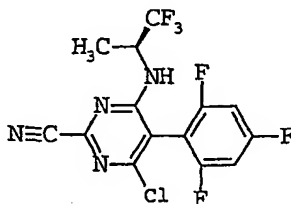


25

Eine Suspension von 2,9 g Butyllithium (15%ige Lösung in Hexan) in 15 ml Tetrahydrofuran [THF] wurde bei -70°C mit 0,62 g (6,6 mmol) Anilin versetzt, dann 1 Stunde bei -70°C nachgerührt. Nach Zusatz von 1,0 g (2,64 mmol) [6-Chlor-5-(2-chlor-6-fluor-phenyl)-2-methansulfonyl-pyrimidin-4-yl]-isopropyl-amin (Abk. Sulfon 3) wurde auf 20 bis 25°C erwärmt. Die Reaktionsmischung wurde in Eiswasser gegossen und mit Salzsäure angesäuert. Es wurde mit 2 x 40 ml MTBE extrahiert, aus den vereinigten organi-  
 30 schen Phasen wurde nach Trocknen und Abdestillieren des Lösungs-  
 35 mittels 1,0 g der Titelverbindung erhalten.

Beispiel 9: Herstellung von 4-Chlor-6-((S)-1-trifluormethyl-ethylamino)-5-(2,4,6-trifluorphenyl)-pyrimidin-2-carbonitril [I-73]

40

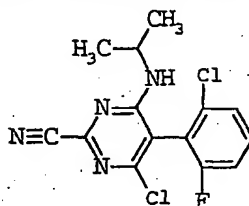


45

Eine Lösung von 0,5 g (1,15 mmol) Sulfon 1 und 0,36 g (2,31 mmol) Tetraethylammoniumcyanid in Dichlormethan wurde 20 Std. bei 20 bis 25°C gerührt. Nach Abdestillieren des Lösungsmittels und Chromatographie an Kieselgel (Cyclohexan [CH]:MTBE 9:1) wurden 0,18 g 5 der Titelverbindung vom Fp. 134-136°C erhalten.

Beispiel 10: Herstellung von 4-Chlor-5-(2-chlor-6-fluorphenyl)-6-isopropylamino-pyrimidin-2-carbonitril [I-74]

10



15 Eine Lösung von 1,0 g (2,63 mmol) Sulfon 3 und 0,21 g (3,16 mmol) Kaliumcyanid in Acetonitril wurde 5 Tage bei 20 bis 25°C gerührt. Das Lösungsmittel wurde abdestilliert und der Rückstand in MTBE:Essigsäureethylester [EE] 9:1 digeriert. Nach Abfiltrieren und Einengen des Filtrats wurden 0,61 g der Titelverbindung vom Fp. 186-188°C erhalten.

25

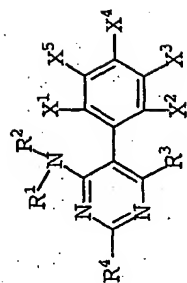
30

35

40

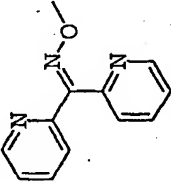
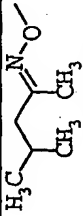
45

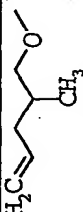
Tabelle I




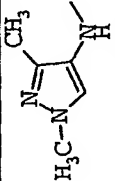
| Nr. | R <sup>1</sup>                          | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>   | X <sup>1</sup> | X <sup>2</sup> | X <sup>3</sup> | X <sup>4</sup> | X <sup>5</sup> | phys. Daten<br>(Fp. [°C]) |
|-----|---|----------------|----------------|--|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|---------------------------|
| I-1 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             | -O-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                    | F              | F              | H              | F              | H              | 157-159                   |
| I-2 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             |  | F              | F              | H              | F              | H              | 88-92                     |
| I-3 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             |  | F              | F              | H              | F              | H              | 176-179                   |
| I-4 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             | -O-N=C(CH <sub>3</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>    | F              | F              | H              | F              | H              | 151-155                   |
| I-5 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             | -ON=C(CH <sub>3</sub> )-OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | F              | F              | H              | F              | H              | 110-112                   |
| I-6 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             | -O-N=CHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                     | F              | F              | H              | F              | H              | 145-146                   |
| I-7 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             | -O-N=CHCH <sub>3</sub>                                   | F              | F              | H              | F              | H              | 139-141                   |
| I-8 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             |  | F              | F              | H              | F              | H              | 350                       |

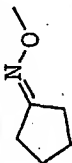
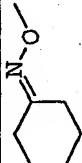
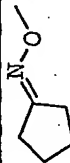




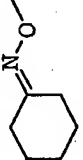

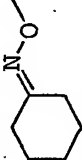
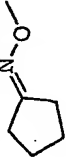
| Nr.  | R <sup>1</sup>                          | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>  | X <sup>1</sup> | X <sup>2</sup> | X <sup>3</sup> | X <sup>4</sup> | X <sup>5</sup> | phys. Daten<br>(Fp. [°C]) |
|------|---|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|---------------------------|
| I-9  | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             |  | F              | F              | H              | F              | H              | 84-86                     |
| I-10 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             |   | F              | F              | H              | F              | H              | 68-70                     |
| I-11 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             | -O-N=CH(2,6-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> )                        | F              | F              | H              | F              | H              | 87-90                     |
| I-12 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>       | H              | Cl             | -O-CH <sub>3</sub>  | F              | F              | H              | F              | H              | 137-139                   |
| I-13 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>       | H              | Cl             | -O-CH <sub>3</sub>  | Cl             | F              | H              | H              | H              | 147-149                   |
| I-14 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>       | H              | Cl             | -O-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>  | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-15 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>       | H              | Cl             | -O-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>  | Cl             | F              | H              | H              | H              | 165-168                   |
| I-16 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>       | H              | Cl             | -O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                  | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-17 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>       | H              | Cl             | -O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                  | Cl             | F              | H              | H              | H              | 110-112                   |
| I-18 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>       | H              | Cl             | -O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | Cl             | F              | H              | H              | H              | 125-127                   |
| I-19 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             | -O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | F              | F              | H              | F              | H              | 116-117                   |
| I-20 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>       | H              | Cl             | -O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                  | Cl             | F              | H              | H              | H              | 98-100                    |
| I-21 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>       | H              | Cl             | -O-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>   | Cl             | F              | H              | H              | H              | 118-121                   |
| I-22 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>       | H              | Cl             | -O-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                              | Cl             | F              | H              | H              | H              | 108-111                   |
| I-23 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             | -O-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                              | F              | F              | H              | F              | H              | 129-131                   |
| I-24 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             | -O-CH <sub>3</sub>  | F              | F              | H              | F              | H              | 121-129                   |

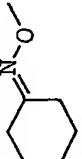
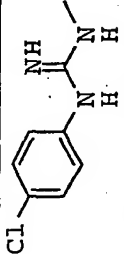

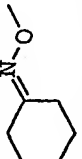
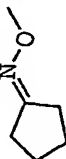
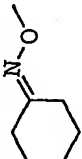
| Nr.  | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>   | X <sup>1</sup> | X <sup>2</sup> | X <sup>3</sup> | X <sup>4</sup> | X <sup>5</sup> | phys. Daten<br>(Fp. [°C]) |
|------|--|----------------|----------------|--|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|---------------------------|
| I-25 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>  | H              | Cl             | -O-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | F              | F              | H              | F              | H              | 147-149                   |
| I-26 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>  | H              | Cl             | -O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | F              | F              | H              | F              | H              | 159-161                   |
| I-27 | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> - |                | Cl             | -HO  | Cl             | F              | H              | H              | H              | 164-169                   |
| I-28 | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> - |                | Cl             | -O-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-29 | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> - |                | Cl             |  | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-30 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H              | Cl             | -S-CH <sub>3</sub>   | F              | F              | H              | F              | H              | 112-116                   |
| I-31 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H              | Cl             | -S-CH <sub>3</sub>   | Cl             | F              | H              | H              | H              | 106-110                   |
| I-32 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H              | Cl             | -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-33 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H              | Cl             | -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | Cl             | F              | H              | H              | H              | 104-108                   |
| I-34 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H              | Cl             | -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 | F              | F              | H              | F              | H              | 95-98                     |
| I-35 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H              | Cl             | -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 | Cl             | F              | H              | H              | H              | Öl                        |
| I-36 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H              | Cl             | -S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-37 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H              | Cl             | -S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | Cl             | F              | H              | H              | H              | 111-113                   |
| I-38 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H              | Cl             | -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | Cl             | F              | H              | H              | H              | Öl                        |
| I-39 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H              | Cl             | -S-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | Cl             | F              | H              | H              | H              | 94-96                     |
| I-40 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H              | Cl             | -S-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                             | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-41 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H              | Cl             | -S-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                             | Cl             | F              | H              | H              | H              | 114-117                   |
| I-42 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>  | H              | Cl             | -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-43 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>  | H              | Cl             | -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 | F              | F              | H              | F              | H              | 68-69                     |

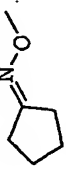
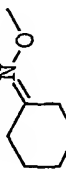
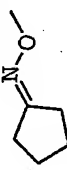
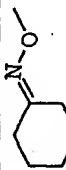
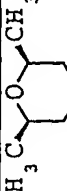

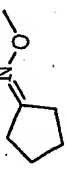



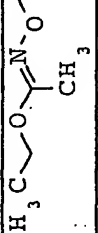
| Nr.  | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>                  | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>   | X <sup>1</sup> | X <sup>2</sup> | X <sup>3</sup> | X <sup>4</sup> | X <sup>5</sup> | phys. Daten<br>(Fp. [°C]) |
|------|--|---------------------------------|----------------|--|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|---------------------------|
| I-44 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>  | H                               | Cl             | -S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                     | F              | F              | H              | F              | H              | 73-76                     |
| I-45 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>  | H                               | Cl             | -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>       | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-46 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>  | H                               | Cl             | -S-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                                      | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-47 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>  | H                               | Cl             | -S-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   | F              | F              | H              | F              | H              | 64-65                     |
| I-48 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>   | H                               | Cl             | -S-CH <sub>3</sub>   | F              | H              | H              | H              | H              | 124-126                   |
| I-49 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | Cl             | -S-CH <sub>3</sub>   | F              | H              | H              | H              | H              | Öl                        |
| I-50 | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> - |                                 | Cl             | -S-CH <sub>3</sub>   | F              | H              | H              | H              | H              | Öl                        |
| I-51 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H                               | Cl             | -S-CH <sub>3</sub>   | F              | H              | H              | H              | H              | Öl                        |
| I-52 | -CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -                                    |                                 | Cl             | -S-CH <sub>3</sub>   | F              | H              | H              | H              | H              | Öl                        |
| I-53 | CH <sub>2</sub> -Ph  | H                               | Cl             | -S-CH <sub>3</sub>   | F              | H              | H              | H              | H              | 135-137                   |
| I-54 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>  | H                               | Cl             | -N(CH <sub>3</sub> )-N=C(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>                | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-55 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>  | H                               | Cl             | -N(CH <sub>3</sub> )-N=C(CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-56 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H                               | Cl             | -NH-N=C(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>                                 | F              | F              | H              | F              | H              | 205-207                   |
| I-57 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H                               | Cl             | -NH-N=C(CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | F              | F              | H              | F              | H              | 185-187                   |
| I-58 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H                               | Cl             | -NH-N=C(CF <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | F              | F              | H              | F              | H              | 84-87                     |
| I-59 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H                               | Cl             | -NH-N=CH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                   | F              | F              | H              | F              | H              | 138-140                   |
| I-60 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>  | H                               | Cl             | -N(CH <sub>3</sub> )-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                  | F              | F              | H              | F              | H              | 205-208                   |
| I-61 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>  | H                               | Cl             | -N(CH <sub>3</sub> )-N=CH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                  | F              | F              | H              | F              | H              | 152-155                   |
| I-62 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>  | H                               | Cl             | -NH-NH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                     | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |

| Nr.  | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>  | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>   | X <sup>1</sup> | X <sup>2</sup> | X <sup>3</sup> | X <sup>4</sup> | X <sup>5</sup> | phys. Daten<br>(Fp. [°C]) |
|------|--|-----------------|----------------|--|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|---------------------------|
| I-63 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>  | H               | Cl             |  | F              | F              | H              | F              | H              | 132-134                   |
| I-64 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>  | H               | Cl             | -N(CH <sub>3</sub> )-NH <sub>2</sub>   | F              | F              | H              | F              | H              | 126-128                   |
| I-65 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>  | H               | Cl             | -NH-NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>   | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-66 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>  | H               | Cl             | -N <sub>3</sub>  | F              | F              | H              | F              | H              | 152-154                   |
| I-67 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H               | Cl             | -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | Cl             | F              | H              | H              | H              | 91-94                     |
| I-68 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H               | Cl             | -NH-OCH <sub>3</sub>   | Cl             | F              | H              | H              | H              | 151-153                   |
| I-69 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H               | Cl             | -NH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>  | Cl             | F              | H              | H              | H              | Öl                        |
| I-70 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H               | Cl             |  | Cl             | F              | H              | H              | H              | Öl                        |
| I-71 | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> - |                 | Cl             | -NHCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | Cl             | F              | H              | H              | H              | 107-109                   |
| I-72 | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> - |                 | Cl             | -N(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                  | Cl             | F              | H              | H              | H              | Öl                        |
| I-73 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>  | H               | Cl             | -CN  | F              | F              | H              | F              | H              | 134-136                   |
| I-74 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H               | Cl             | -CN  | Cl             | F              | H              | H              | H              | 186-188                   |
| I-75 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>  | H               | Cl             | -CH <sub>3</sub>   | F              | F              | H              | F              | H              | 83-85                     |
| I-76 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>  | H               | Cl             | -CH <sub>3</sub>   | Cl             | F              | H              | H              | H              | 87-90                     |
| I-77 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | CH <sub>3</sub> | Cl             | -CH <sub>3</sub>   | H              | H              | F              | H              | H              | 75-77                     |
| I-78 | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> - |                 | Cl             | -CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | Cl             | F              | H              | H              | H              | Öl                        |
| I-79 | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> - |                 | Cl             | -CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>  | Cl             | F              | H              | H              | H              | Öl                        |

| Nr.  | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>  | X <sup>1</sup>  | X <sup>2</sup> | X <sup>3</sup> | X <sup>4</sup>   | X <sup>5</sup> | phys. Daten<br>(Fp. [°C]) |
|------|--|----------------|----------------|---|-----------------|----------------|----------------|------------------|----------------|---------------------------|
| I-80 | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> - |                | Cl             | -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | Cl              | F              | H              | H                | H              | Öl                        |
| I-81 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>  | H              | Cl             | -S-CH <sub>3</sub>  | F               | F              | H              | F                | H              | 94-96                     |
| I-82 | C(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                     | H              | Cl             | -O-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | F               | F              | H              | F                | H              | 91                        |
| I-83 | C(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                     | H              | Cl             |   | F               | F              | H              | F                | H              | 180                       |
| I-84 | C(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                     | H              | Cl             |   | F               | F              | H              | F                | H              | 157                       |
| I-85 | C(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                     | H              | Cl             | -O-N=CH(2,6-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> )                        | F               | F              | H              | F                | H              | 159                       |
| I-86 | C(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                     | H              | Cl             | -CN   | F               | F              | H              | F                | H              | 113-118                   |
| I-87 | (R)-C(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 | H              | Cl             | -CF <sub>3</sub>  | F               | F              | H              | OCH <sub>3</sub> | H              | Öl                        |
| I-88 | -CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -                 |                | Cl             | -O-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | F               | F              | H              | F                | H              | Öl                        |
| I-89 | -CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -                 |                | Cl             |   | F               | F              | H              | F                | H              | Öl                        |
| I-90 | -CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -                 |                | Cl             |  | F               | F              | H              | F                | H              | Öl                        |
| I-91 | -CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -                 |                | Cl             | -NH-C(=NH)CH <sub>3</sub>   | F               | F              | H              | F                | H              | Öl                        |
| I-92 | -CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -                 |                | Cl             | -NH-C(=NH)CH <sub>3</sub>   | Cl              | F              | H              | H                | H              | Öl                        |
| I-93 | -CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )-             |                | Cl             | -NH-C(=NH)CH <sub>3</sub>   | F               | H              | H              | CH <sub>3</sub>  | H              | Öl                        |
| I-94 | -CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -                 |                | Cl             | -NH-C(=NH)CH <sub>3</sub>   | CH <sub>3</sub> | H              | H              | CH <sub>3</sub>  | H              | Öl                        |
| I-95 | (R)-C(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                               | H              | Cl             | -CN   | F               | F              | H              | F                | H              | 99-105                    |

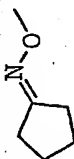
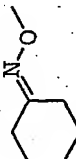
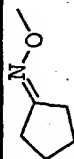
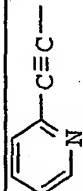
| Nr.   | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>   | X <sup>1</sup> | X <sup>2</sup> | X <sup>3</sup> | X <sup>4</sup>   | X <sup>5</sup> | phys. Daten<br>(Fp. [°C]) |
|-------|--|----------------|----------------|--|----------------|----------------|----------------|------------------|----------------|---------------------------|
| I-96  | (R)-C(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | Cl             | -O-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | F              | F              | H              | F                | H              | 120-123                   |
| I-97  | (R)-C(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | Cl             |    | F              | F              | H              | F                | H              | 106-109                   |
| I-98  | (R)-C(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | Cl             |    | F              | F              | H              | F                | H              | 120-123                   |
| I-99  | (R)-C(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | Cl             | -OH  | F              | F              | H              | F                | H              | 84-101                    |
| I-100 | (R)-C(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | Cl             | -CN  | F              | F              | H              | F                | H              | 156-158                   |
| I-101 | (S)-C(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | Cl             | -NH-C(=NH)CH <sub>3</sub>  | F              | F              | H              | F                | H              | Öl                        |
| I-102 | (R)-C(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | Cl             | -O-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | Cl             | F              | H              | H                | H              | Öl                        |
| I-103 | (R)-C(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | Cl             |    | Cl             | F              | H              | H                | H              | Öl                        |
| I-104 | (R)-C(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | Cl             |    | Cl             | F              | H              | H                | H              | Öl                        |
| I-105 | (R)-C(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | Cl             | -ON=C(CH <sub>3</sub> )-OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                             | Cl             | F              | H              | H                | H              | Öl                        |
| I-106 | (R)-C(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | Cl             | -ON=CH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>   | Cl             | F              | H              | H                | H              | Öl                        |
| I-107 | (R)-C(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | Cl             | -O-N=CH(2,6-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> )                         | Cl             | H              | H              | F                | H              | 127                       |
| I-108 | (R)-C(CH <sub>3</sub> )CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | Cl             | -CF <sub>3</sub>   | F              | F              | H              | OCH <sub>3</sub> | H              | Öl                        |
| I-109 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -                       |                | Cl             | -O-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | F              | F              | H              | F                | H              | 98-102                    |
| I-110 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -                       |                | Cl             |  | F              | F              | H              | F                | H              | Öl                        |

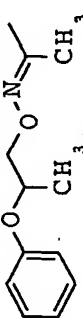
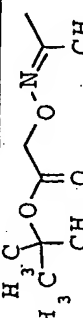
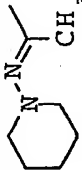
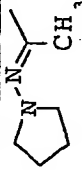
| Nr.   | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>   | X <sup>1</sup> | X <sup>2</sup> | X <sup>3</sup> | X <sup>4</sup> | X <sup>5</sup> | phys. Daten<br>(Fp. [°C]) |
|-------|--|----------------|----------------|--|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|---------------------------|
| I-111 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -   |                | Cl             |    | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-112 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -   |                | Cl             |    | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-113 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -   |                | Cl             | -NH-C(=O)CH <sub>3</sub>   | F              | F              | H              | F              | H              | 123-125                   |
| I-114 | CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                  | H              | Cl             | -ON=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | F              | F              | H              | F              | H              | 133                       |
| I-115 | CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                  | H              | Cl             |    | F              | F              | H              | F              | H              | 155                       |
| I-116 | CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                  | H              | Cl             |    | F              | F              | H              | F              | H              | 146                       |
| I-117 | CH(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                  | H              | Cl             | -CN  | F              | F              | H              | F              | H              | 126-129                   |
| I-118 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> -             |                | Cl             | -O-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-119 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> -             |                | Cl             |   | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-120 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> -             |                | Cl             |  | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-121 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> -             |                | Cl             | -CN  | F              | F              | H              | F              | H              | 107-109                   |
| I-122 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> -             |                | Cl             | -CH <sub>3</sub>   | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-123 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             | -O-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | F              | F              | H              | F              | H              | 141-149                   |

| Nr.   | R <sup>1</sup>  | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>   | X <sup>1</sup> | X <sup>2</sup> | X <sup>3</sup> | X <sup>4</sup> | X <sup>5</sup> | phys. Daten<br>(Fp. [°C]) |
|-------|---|----------------|----------------|--|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|---------------------------|
| I-124 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -    |                | Cl             |    | F              | F              | H              | F              | H              | 179-188                   |
| I-125 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -    |                | Cl             |    | F              | F              | H              | F              | H              | 181-191                   |
| I-126 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -    |                | Cl             | -NH-C(=NH)CH <sub>3</sub>  | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-127 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub> -                               |                | Cl             | -ON=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-128 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub> -                               |                | Cl             |    | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-129 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub> -                               |                | Cl             |    | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-130 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub> -                               |                | Cl             | CN   | F              | F              | H              | F              | H              | 89-98                     |
| I-131 |    |                | Cl             | -ON=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | F              | F              | H              | F              | H              | 82-90                     |
| I-132 |   |                | Cl             |   | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-133 |  |                | Cl             |  | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-134 |  |                | Cl             |  | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |

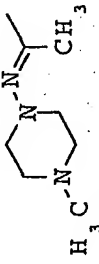
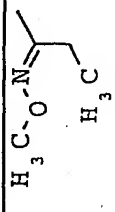

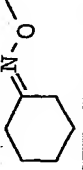
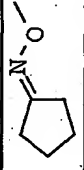
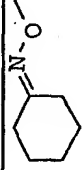


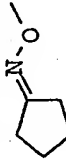
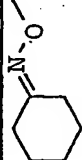
| Nr.   | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>   | R <sup>3</sup>  | R <sup>4</sup>   | X <sup>1</sup>  | X <sup>2</sup>  | X <sup>3</sup> | X <sup>4</sup> | X <sup>5</sup> | phys. Daten<br>(Fp. [°C]) |
|-------|--|--|-----------------|--|-----------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|---------------------------|
| I-135 |  |  | Cl              |  | F               | F               | H              | F              | H              | 96                        |
| I-136 |  |  | Cl              |  | F               | F               | H              | F              | H              | 72                        |
| I-137 |  |  | Cl              | -ON=CH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                         | F               | F               | H              | F              | H              | 125                       |
| I-138 |  |  | Cl              | -ON=C(CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>        | F               | F               | H              | F              | H              | 119                       |
| I-139 |  |  | Cl              | -O-N=CH(2,6-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> ) | F               | F               | H              | F              | H              | 154                       |
| I-140 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | Cl              | -O-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                        | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | H              | H              | Öl                        |
| I-141 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | Cl              | -O-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                        | F               | F               | H              | F              | H              | 98-102                    |
| I-142 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | CH <sub>3</sub> | -O-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                        | F               | F               | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-143 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | Cl              |  | F               | F               | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-144 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | Cl              |  | F               | F               | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-145 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - | Cl              |  | F               | F               | H              | F              | H              | Öl                        |

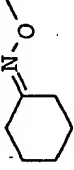
| Nr.   | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>   | R <sup>4</sup>   | X <sup>1</sup>  | X <sup>2</sup> | X <sup>3</sup> | X <sup>4</sup> | X <sup>5</sup> | phys. Daten<br>(Fp. [°C]) |
|-------|--|----------------|------------------|--|-----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|---------------------------|
| I-146 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl               | -ON=C(CH <sub>3</sub> )-OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                             | F               | F              | H              | F              | H              | 70                        |
| I-147 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl               | -ON=CH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>   | F               | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-148 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl               | -ON=C(CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                | F               | F              | H              | F              | H              | 96                        |
| I-149 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl               | -O-N=CH(2,6-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> )                         | F               | H              | H              | F              | H              | 128                       |
| I-150 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | OCH <sub>3</sub> | -ON=C(CH <sub>3</sub> )-OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                             | F               | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-151 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | OCH <sub>3</sub> |    | CH <sub>3</sub> | H              | H              | F              | H              | 105                       |
| I-152 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | OCH <sub>3</sub> |    | F               | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-153 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | OCH <sub>3</sub> |    | F               | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-154 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | OCH <sub>3</sub> | -ON=CH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>   | F               | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-155 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | OCH <sub>3</sub> | -O-N=CH(2,6-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> )                         | F               | H              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-156 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl               | -OH  | F               | F              | H              | F              | H              | 239-242                   |
| I-157 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl               | -CH <sub>3</sub>   | F               | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-158 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl               | -CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | F               | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-159 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | OCH <sub>3</sub> | -CN  | F               | F              | H              | F              | H              | 106-124                   |
| I-160 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl               | -CN  | F               | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-161 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl               |  | F               | F              | H              | F              | H              | Öl                        |

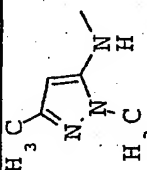
| Nr.   | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>   | X <sup>1</sup> | X <sup>2</sup> | X <sup>3</sup> | X <sup>4</sup> | X <sup>5</sup> | phys. Daten<br>(Fp. [°C]) |
|-------|--|----------------|----------------|--|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|---------------------------|
| I-162 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             | -C(CH <sub>3</sub> )=N-OCH <sub>3</sub>  | F              | F              | H              | F              | H              | 117                       |
| I-163 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             | -C(CH <sub>3</sub> )=N-OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                              | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-164 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             | -C(CH <sub>3</sub> )=N-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>              | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-165 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             | -C(CH <sub>3</sub> )=N-OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-166 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             | -C(CH <sub>3</sub> )=N-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH <sub>3</sub>              | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-167 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             | -C(CH <sub>3</sub> )=N-OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>                             | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-168 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             | -C(CH <sub>3</sub> )=N-OCH <sub>2</sub> CH=CHCl                                      | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-169 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             | -C(CH <sub>3</sub> )=N-OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>                           | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-170 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             | -C(CH <sub>3</sub> )=N-OCH <sub>2</sub> CCl=CH <sub>2</sub>                          | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-171 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             | -C(CH <sub>3</sub> )=N-O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>             | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-172 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             |    | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-173 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             |    | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-174 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             | -C(CH <sub>3</sub> )=N-NH-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                           | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-175 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             |  | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-176 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             |  | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |

| Nr.   | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>   | X <sup>1</sup> | X <sup>2</sup> | X <sup>3</sup> | X <sup>4</sup> | X <sup>5</sup> | phys. Daten<br>(Fp. [°C]) |
|-------|--|----------------|----------------|--|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|---------------------------|
| I-177 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             |  | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-178 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             |  | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-179 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             |  | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-180 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             |  | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-181 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             | -C(CH <sub>3</sub> )=N-N(CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-182 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             |  | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-183 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             |  | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |

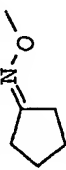
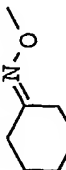
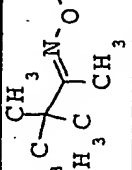
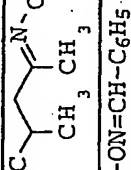
| Nr.   | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>   | X <sup>1</sup>  | X <sup>2</sup>  | X <sup>3</sup> | X <sup>4</sup>   | X <sup>5</sup> | phys. Daten<br>(Fp. [°C]) |
|-------|--|----------------|----------------|--|-----------------|-----------------|----------------|------------------|----------------|---------------------------|
| I-184 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             |    | F               | F               | H              | F                | H              | Öl                        |
| I-185 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             | -C(NH <sub>2</sub> )=N-OH  | F               | F               | H              | F                | H              | Öl                        |
| I-186 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             | -C(NH <sub>2</sub> )=N-OCH <sub>3</sub>  | F               | F               | H              | F                | H              | Öl                        |
| I-187 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             |    | F               | F               | H              | F                | H              | Öl                        |
| I-188 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             | -CN  | CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub> | H              | H                | H              | Öl                        |
| I-189 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             | -O-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | F               | F               | H              | OCH <sub>3</sub> | H              | Öl                        |
| I-190 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             |    | F               | F               | H              | OCH <sub>3</sub> | H              | Öl                        |
| I-191 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             |    | F               | F               | H              | OCH <sub>3</sub> | H              | Öl                        |
| I-192 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             | -CN  | F               | F               | H              | OCH <sub>3</sub> | H              | Öl                        |
| I-193 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             | -CF <sub>3</sub>   | F               | F               | H              | OCH <sub>3</sub> | H              | Öl                        |
| I-194 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             | -O-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | Cl              | F               | H              | H                | H              | 109                       |
| I-195 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             |  | Cl              | F               | H              | H                | H              | Öl                        |
| I-196 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl             |  | Cl              | F               | H              | H                | H              | Öl                        |

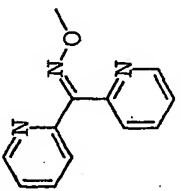
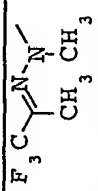
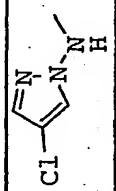
| Nr.   | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup>   | R <sup>4</sup>  | X <sup>1</sup> | X <sup>2</sup> | X <sup>3</sup> | X <sup>4</sup>  | X <sup>5</sup> | phys. Daten<br>(Fp. [°C]) |
|-------|--|----------------|------------------|---|----------------|----------------|----------------|-----------------|----------------|---------------------------|
| I-197 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl               | -O-N=CH(2,6-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> )                        | Cl             | F              | H              | H               | H              | 126                       |
| I-198 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl               | -OH   | Cl             | F              | H              | H               | H              | 164-169                   |
| I-199 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl               | -O-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>  | Cl             | F              | H              | H               | H              | Öl                        |
| I-200 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl               | -O-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>           | Cl             | F              | H              | H               | H              | Öl                        |
| I-201 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl               | -NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                 | Cl             | F              | H              | H               | H              | 107-109                   |
| I-202 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl               | -N(CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>                                   | Cl             | F              | H              | H               | H              | Öl                        |
| I-203 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl               | -CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>  | Cl             | F              | H              | H               | H              | Öl                        |
| I-204 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl               | -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | Cl             | F              | H              | H               | H              | Öl                        |
| I-205 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl               | -CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>   | Cl             | F              | H              | H               | H              | Öl                        |
| I-206 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl               | -CN   | Cl             | F              | H              | H               | H              | Öl                        |
| I-207 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl               | -S-CH <sub>3</sub>  | F              | H              | H              | H               | H              | Öl                        |
| I-208 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl               | -O-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | F              | H              | H              | CH <sub>3</sub> | H              | Öl                        |
| I-209 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl               |   | F              | H              | H              | CH <sub>3</sub> | H              | 136                       |
| I-210 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl               |  | F              | H              | H              | CH <sub>3</sub> | H              | Öl                        |
| I-211 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl               | -CN   | F              | H              | H              | CH <sub>3</sub> | H              | 95-97                     |
| I-212 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | OCH <sub>3</sub> | -O-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | F              | H              | H              | CH <sub>3</sub> | H              | Öl                        |
| I-213 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                | Cl               | -O-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | F              | H              | H              | CH <sub>3</sub> | H              | Öl                        |


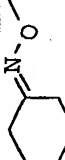
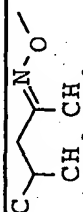
| Nr.   | R <sup>1</sup>   | R <sup>2</sup>                  | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>   | X <sup>1</sup> | X <sup>2</sup> | X <sup>3</sup> | X <sup>4</sup>  | X <sup>5</sup> | phys. Daten<br>(Fp. [°C]) |
|-------|--|---------------------------------|----------------|--|----------------|----------------|----------------|-----------------|----------------|---------------------------|
| I-214 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                                 | Cl             |  | F              | H              | H              | CH <sub>3</sub> | H              | Öl                        |
| I-215 | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - |                                 | Cl             | -O-N=CH(2,6-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> )                       | F              | H              | H              | CH <sub>3</sub> | H              | 148                       |
| I-216 | -CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -                                    |                                 | Cl             | -S-CH <sub>3</sub>   | F              | H              | H              | H               | H              | Öl                        |
| I-217 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>  | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | Cl             | -S-CH <sub>3</sub>   | F              | H              | H              | H               | H              | Öl                        |
| I-218 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | CH <sub>3</sub>                 | Cl             | -CH <sub>3</sub>   | H              | H              | F              | H               | H              | 75-77                     |
| I-219 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H                               | Cl             | -O-N=C(CH <sub>3</sub> )CF <sub>3</sub>  | F              | F              | H              | F               | H              | 205-207                   |
| I-220 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H                               | Cl             | -NH-N=C(CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                            | F              | F              | H              | F               | H              | 185-187                   |
| I-221 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H                               | Cl             | -NH-N=C(CF <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                            | F              | F              | H              | F               | H              | 84-87                     |
| I-222 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H                               | Cl             | -NH-N=CH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>   | F              | F              | H              | F               | H              | 138-140                   |
| I-223 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H                               | Cl             | -O-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | F              | F              | H              | F               | H              | Öl                        |
| I-224 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H                               | Cl             | -O-CH <sub>3</sub>   | F              | F              | H              | F               | H              | 137-139                   |
| I-225 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H                               | Cl             | -O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 | F              | F              | H              | F               | H              | Öl                        |
| I-226 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H                               | Cl             | -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | F              | F              | H              | F               | H              | Öl                        |
| I-227 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H                               | Cl             | -S-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>                             | F              | F              | H              | F               | H              | Öl                        |
| I-228 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H                               | Cl             | -S-CH <sub>3</sub>   | F              | F              | H              | F               | H              | 112-116                   |
| I-229 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H                               | Cl             | -S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | F              | F              | H              | F               | H              | Öl                        |
| I-230 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H                               | Cl             | -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 | F              | F              | H              | F               | H              | 95-98                     |
| I-231 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H                               | Cl             | -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | Cl             | F              | H              | H               | H              | 91-94                     |
| I-232 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | H                               | Cl             | -NHCH <sub>3</sub>   | Cl             | F              | H              | H               | H              | 151-153                   |

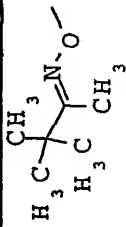
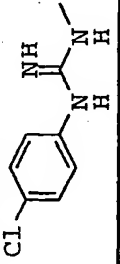
| Nr.   | R <sup>1</sup>                    | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>   | X <sup>1</sup> | X <sup>2</sup> | X <sup>3</sup> | X <sup>4</sup> | X <sup>5</sup> | phys. Daten<br>(Fp. [°C]) |
|-------|-----------------------------------|----------------|----------------|--|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|---------------------------|
| I-233 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | Cl             | -NH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>  | Cl             | F              | H              | H              | H              | Öl                        |
| I-234 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | Cl             |  | Cl             | F              | H              | H              | H              | Öl                        |
| I-235 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | Cl             | -O-CH <sub>3</sub>   | Cl             | F              | H              | H              | H              | 147-149                   |
| I-236 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | Cl             | -O-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | Cl             | F              | H              | H              | H              | 165-168                   |
| I-237 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | Cl             | -O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 | Cl             | F              | H              | H              | H              | 110-112                   |
| I-238 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | Cl             | -O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | Cl             | F              | H              | H              | H              | 125-127                   |
| I-239 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | Cl             | -O-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | Cl             | F              | H              | H              | H              | 118-121                   |
| I-240 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | Cl             | -O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | Cl             | F              | H              | H              | H              | 98-100                    |
| I-241 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | Cl             | -O-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                             | Cl             | F              | H              | H              | H              | 108-111                   |
| I-242 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | Cl             | -S-CH <sub>3</sub>   | Cl             | F              | H              | H              | H              | 106-110                   |
| I-243 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | Cl             | -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                 | Cl             | F              | H              | H              | H              | Öl                        |
| I-244 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | Cl             | -S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | Cl             | F              | H              | H              | H              | 111-113                   |
| I-245 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | Cl             | -S-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | Cl             | F              | H              | H              | H              | 94-96                     |
| I-246 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | Cl             | -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 | Cl             | F              | H              | H              | H              | Öl                        |
| I-247 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | Cl             | -S-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                             | Cl             | F              | H              | H              | H              | 114-117                   |
| I-248 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | Cl             | -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | Cl             | F              | H              | H              | H              | 104-108                   |
| I-249 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | Cl             | -CN  | Cl             | F              | H              | H              | H              | 186-188                   |
| I-250 | CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> | H              | Cl             | -S-CH <sub>3</sub>   | F              | H              | H              | H              | H              | Öl                        |



| Nr.   | R <sup>1</sup>                                 | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>  | X <sup>1</sup> | X <sup>2</sup> | X <sup>3</sup> | X <sup>4</sup> | X <sup>5</sup> | phys. Daten<br>(Fp. [°C]) |
|-------|--|----------------|----------------|---|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|---------------------------|
| I-251 | CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>             | H              | Cl             | -S-CH <sub>3</sub>  | F              | H              | H              | H              | H              | 124-126                   |
| I-252 | CH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> | H              | Cl             | -S-CH <sub>3</sub>  | F              | H              | H              | H              | H              | 135-137                   |
| I-253 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>        | H              | Cl             | -O-N=CHCH <sub>3</sub>  | F              | F              | H              | F              | H              | 139-141                   |
| I-254 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>        | H              | Cl             | -O-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | F              | F              | H              | F              | H              | 157-159                   |
| I-255 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>        | H              | Cl             |   | F              | F              | H              | F              | H              | 88-92                     |
| I-256 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>        | H              | Cl             |   | F              | F              | H              | F              | H              | 176-179                   |
| I-257 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>        | H              | Cl             | -ON=C(CH <sub>3</sub> )-OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                            | F              | F              | H              | F              | H              | 110-112                   |
| I-258 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>        | H              | Cl             |   | F              | F              | H              | F              | H              | 350                       |
| I-259 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>        | H              | Cl             |  | F              | F              | H              | F              | H              | 68-70                     |
| I-260 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>        | H              | Cl             | -ON=CH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>  | F              | F              | H              | F              | H              | 145-146                   |
| I-261 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>        | H              | Cl             | -ON=C(CH <sub>3</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                                | F              | F              | H              | F              | H              | 151-155                   |
| I-262 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>        | H              | Cl             | -O-N=CH(2,6-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> )                        | F              | F              | H              | F              | H              | 87-90                     |

| Nr.   | R <sup>1</sup>                          | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>   | X <sup>1</sup> | X <sup>2</sup> | X <sup>3</sup> | X <sup>4</sup> | X <sup>5</sup> | phys. Daten<br>(Fp. [°C]) |
|-------|---|----------------|----------------|--|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|---------------------------|
| I-263 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             |  | F              | F              | H              | F              | H              | 84-86                     |
| I-264 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             |  | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-265 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             | -N(CH <sub>3</sub> )-N=C(CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>           | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-266 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             | -N(CH <sub>3</sub> )-N=CH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                            | F              | F              | H              | F              | H              | 152-155                   |
| I-267 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             | -N(CH <sub>3</sub> )-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                            | F              | F              | H              | F              | H              | 205-208                   |
| I-268 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             | -NH-C(=NH)CH <sub>3</sub>  | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-269 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             | -NH-NH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>   | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-270 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             |  | F              | F              | H              | F              | H              | 132-134                   |
| I-271 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             | -N(CH <sub>3</sub> )-NH <sub>2</sub>   | F              | F              | H              | F              | H              | 126-128                   |
| I-272 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             | -NH-NH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>   | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-273 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             | -N <sub>3</sub>  | F              | F              | H              | F              | H              | 152-154                   |
| I-274 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             | -OH  | F              | F              | H              | F              | H              | 137-146                   |
| I-275 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             | -O-CH <sub>3</sub>   | F              | F              | H              | F              | H              | 121-129                   |
| I-276 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             | -O-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | F              | F              | H              | F              | H              | 147-149                   |

| Nr.   | R <sup>1</sup>                            | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>   | X <sup>1</sup> | X <sup>2</sup> | X <sup>3</sup> | X <sup>4</sup> | X <sup>5</sup> | phys. Daten<br>(Fp. [°C]) |
|-------|---|----------------|----------------|--|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|---------------------------|
| I-277 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>   | H              | Cl             | -O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | F              | F              | H              | F              | H              | 159-161                   |
| I-278 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>   | H              | Cl             | -O-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   | F              | F              | H              | F              | H              | 116-117                   |
| I-279 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>   | H              | Cl             | -O-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                               | F              | F              | H              | F              | H              | 129-131                   |
| I-280 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>   | H              | Cl             | -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-281 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>   | H              | Cl             | -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                   | F              | F              | H              | F              | H              | 68-69                     |
| I-282 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>   | H              | Cl             | -S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   | F              | F              | H              | F              | H              | 73-76                     |
| I-283 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>   | H              | Cl             | -S-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>  | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-284 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>   | H              | Cl             | -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-285 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>   | H              | Cl             | -S-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                               | F              | F              | H              | F              | H              | 64-65                     |
| I-286 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>   | H              | Cl             | -CH <sub>3</sub>   | F              | F              | H              | F              | H              | 83-85                     |
| I-287 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>   | H              | Cl             | -CN  | F              | F              | H              | F              | H              | 134-136                   |
| I-288 | (S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub>   | H              | Cl             | -CH <sub>3</sub>   | Cl             | F              | H              | H              | H              | 87-90                     |
| I-289 | (R/S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             | -O-N=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | F              | F              | H              | F              | H              | 82                        |
| I-290 | (R/S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             |    | F              | F              | H              | F              | H              | 130                       |
| I-291 | (R/S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             |  | F              | F              | H              | F              | H              | 69                        |
| I-292 | (R/S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             | -ON=C(CH <sub>3</sub> )-OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                             | F              | F              | H              | F              | H              | 120                       |
| I-293 | (R/S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             |  | F              | F              | H              | F              | H              | 87                        |

| Nr.   | R <sup>1</sup>                            | R <sup>2</sup> | R <sup>3</sup> | R <sup>4</sup>   | X <sup>1</sup> | X <sup>2</sup> | X <sup>3</sup> | X <sup>4</sup> | X <sup>5</sup> | phys. Daten<br>(Fp. [°C]) |
|-------|---|----------------|----------------|--|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|---------------------------|
| I-294 | (R/S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             |  | F              | F              | H              | F              | H              | 97                        |
| I-295 | (R/S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             | -ON=CH-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>   | F              | F              | H              | F              | H              | 140                       |
| I-296 | (R/S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             | -ON=C(CH <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>                              | F              | F              | H              | F              | H              | 175                       |
| I-297 | (R/S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             | -ON=CH-(2,6-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> )                       | F              | F              | H              | F              | H              | 157                       |
| I-298 | (R/S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             |  | F              | F              | H              | F              | H              | Öl                        |
| I-299 | (R/S)-CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>3</sub> | H              | Cl             | -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>  | F              | F              | H              | F              | H              | 108-112                   |

Die R<sup>4</sup>-Gruppen sind über die freien Valenzen an den Pyrimidin-Grundkörper gebunden.

Die Gruppen R<sup>4</sup> können aufgrund ihrer C=C-, C=N- und N=N-Doppelbindungen als E/Z-Isomerenmische vorliegen.

### Beispiele für die Wirkung gegen Schadpilze

Die fungizide Wirkung der Verbindungen der Formel I ließ sich  
5 durch die folgenden Versuche zeigen:

Die Wirkstoffe wurden getrennt oder gemeinsam als 10%ige Emulsion  
in einem Gemisch aus 70 Gew.-% Cyclohexanon, 20 Gew.-% Nekanil®  
LN (Lutensol® AP6, Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung  
10 auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) und 10 Gew.-% Wettol®  
EM (nichtionischer Emulgator auf der Basis von ethoxyliertem Ri-  
cinusöl) aufbereitet und entsprechend der gewünschten Konzentra-  
tion mit Wasser verdünnt.

#### 15 Anwendungsbeispiel 1 - Wirksamkeit gegen die Septoria-Blattflek- kenkrankheit des Weizens (*Septoria tritici*)

Blätter von in Töpfen gewachsenen Weizenkeimlingen der Sorte "Ri-  
band" wurden mit wässriger Wirkstoffaufbereitung, die aus einer  
20 Stammlösung bestehend aus 10 % Wirkstoff, 85 % Cyclohexanon und  
5 % Emulgiermittel angesetzt wurde, bis zur Tropfnässe besprüht.  
24 Stunden nach dem Antrocknen des Spritzbelages wurden sie mit  
einer wässrigen Sporensuspension von *Septoria tritici* inokuliert.  
Die Suspension enthielt  $2.0 \times 10^6$  Sporen/ml. Die Versuchspflanzen  
25 wurden anschließend im Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 18  
und 22°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit nahe 100 % aufge-  
stellt. Nach 2 Wochen wurde das Ausmaß der Krankheitsentwicklung  
visuell in % Befall der gesamten Blattfläche ermittelt.

30 In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Wirkstoffe Nr. 1, 12  
bis 15, 18, 19, 21, 24 bis 26, 30, 32, 33, 54, 55, 60, 61 bis 65,  
86, 160, 223, 224, 226, 228, 235 bis 239, 248, 254, 264, 265,  
269, 270, 271, 272 und 275 bis 278 der Tabelle I behandelten  
Pflanzen maximal 7 % Befall, während die unbehandelten Pflanzen  
35 zu 90 % befallen waren.

#### Anwendungsbeispiel 2 - Wirksamkeit gegen die Netzfleckenkrankheit der Gerste (*Pyrenophora teres*)

40 Blätter von in Töpfen gewachsenen Gerstenkeimlingen der Sorte  
"Igri" wurden mit wässriger Wirkstoffaufbereitung, die aus einer  
Stammlösung bestehend aus 10 % Wirkstoff, 85 % Cyclohexanon und  
5 % Emulgiermittel angesetzt wurde, bis zur Tropfnässe besprüht  
und 24 Stunden nach dem Antrocknen des Spritzbelages mit einer  
45 wässrigen Sporensuspension von *Pyrenophora* [syn. *Drechslera*] *te-*  
*res*, dem Erreger der Netzfleckenkrankheit, inokuliert. Anschlie-  
ßend wurden die Versuchspflanzen im Gewächshaus bei Temperaturen

zwischen 20 und 24°C und 95 bis 100 % relativer Luftfeuchtigkeit aufgestellt. Nach 6 Tagen wurde das Ausmaß der Krankheitsentwicklung visuell in % Befall der gesamten Blattfläche ermittelt.

5 In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Wirkstoffe Nr. 1, 55, 60, 64, 73, 88, 130, 134, 160, 163, 165, 168, 171, 185, 186, 254, 255, 265, 267, 271, 274, 276, 277, 278 und 287 der Tabelle I behandelten Pflanzen nicht über 15 % Befall, während die unbehandelten Pflanzen zu 100 % befallen waren.

10

Anwendungsbeispiel 3 - Protektive Wirksamkeit gegen den durch *Sphaerotheca fuliginea* verursachten Gurkenmehltau

Blätter von in Töpfen gewachsenen Gurkenkeimlingen der Sorte  
15 "Chinesische Schlange" wurden im Keimblattstadium mit wässriger Wirkstoffaufbereitung, die aus einer Stammlösung bestehend aus 10 % Wirkstoff, 85 % Cyclohexanon und 5 % Emulgiermittel ange-  
setzt wurde, bis zur Tropfnässe besprüht. 20 Stunden nach dem An-  
trocknen des Spritzbelages wurden die Pflanzen mit einer wässri-  
20 gen Sporensuspension des Gurkenmehltaus (*Sphaerotheca fuliginea*)  
inokuliert. Anschließend wurden die Pflanzen im Gewächshaus bei  
Temperaturen zwischen 20 und 24°C und 60 bis 80 % relativer Luft-  
feuchtigkeit für 7 Tage kultiviert. Dann wurde das Ausmaß der  
Mehltauentwicklung visuell in %-Befall der Keimblattfläche ermit-  
25 telt.

In diesem Test zeigten die mit 250 ppm der Wirkstoffe Nr. 86, 88, 100, 121, 130, 141, 160, 163, 168, 171, 185, 186, 189, 206, 220, 249, 253 bis 261, 265, 266, 271, 273, 275, 276, 287 und 299 der  
30 Tabelle I behandelten Pflanzen nicht über 10 % Befall, während  
die unbehandelten Pflanzen zu 85 % befallen waren.

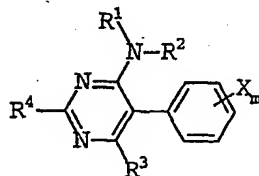
35

40

45

## Patentansprüche:

## 1. 5-Phenylpyrimidine der Formel I



I

in der die Substituenten und der Index folgende Bedeutung haben:

$R^1, R^2$  unabhängig voneinander Wasserstoff,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_3$ - $C_6$ -Halogen-cycloalkyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Halogenalkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkinyl oder  $C_2$ - $C_6$ -Halogenalkinyl,

$R^1$  und  $R^2$  können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gesättigten oder ungesättigten fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch eine Ether-(-O-), Thio-(-S-), Sulfoxyl-(-S[=O]-) oder Sulfenyl-(-SO<sub>2</sub>-) Gruppe unterbrochen sein und durch eine bis vier Gruppen  $R^a$  und/oder  $R^b$  substituiert sein kann;

$R^a, R^b$  unabhängig voneinander Wasserstoff,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_8$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_8$ -Alkinyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy,

$C_3$ - $C_{10}$ -Cycloalkyl, Phenyl oder fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, wobei die cyclischen Reste teilweise oder vollständig substituiert sein können durch folgende Gruppen  $R^x$ :

$R^x$  unabhängig voneinander Cyano, Nitro, Amino, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, Halogen, Hydroxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylcarbonyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfonyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfoxyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl-oxycarbonyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylamino, Di- $C_1$ - $C_6$ -Alkylamino,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylaminocarbonyl, Di- $C_1$ - $C_6$ -Alkylaminocarbonyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylamino-

## 54

thiocarbonyl, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylaminothiocarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, Phenyl, Phenoxy, Benzyl, Benzyloxy, 5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl, 5- oder 6-gliedriges Hetaryl, 5- oder 6-gliedriges Hetaryloxy, C(=NOR<sup>α</sup>)-OR<sup>β</sup> oder OC(R<sup>α</sup>)<sub>2</sub>-C(R<sup>β</sup>)=NOR<sup>β</sup>,

wobei die cyclischen Gruppen ihrerseits unsubstituiert oder substituiert sind durch einen bis drei Reste R<sup>ν</sup>:

R<sup>ν</sup> Cyano, Nitro, Halogen, Hydroxy, Amino, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfoxyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylamino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylaminocarbonyl, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylaminocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylaminothiocarbonyl, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylaminothiocarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkenyl, Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Benzyl, Benzyloxy, 5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl, 5- oder 6-gliedriges Hetaryl, 5- oder 6-gliedriges Hetaryloxy oder C(=NOR<sup>α</sup>)-OR<sup>β</sup>;

R<sup>α</sup>, R<sup>β</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl;

R<sup>a</sup> und R<sup>b</sup> können auch gemeinsam über eine Alkylen- oder Alkenylenkette mit dem überbrückenden Atom einen gesättigten oder ungesättigten fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden;

R<sup>c</sup> eine der bei R<sup>a</sup> und R<sup>b</sup> genannten monovalenten Gruppen;

R<sup>3</sup> Wasserstoff, Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy oder C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyloxy;

R<sup>4</sup> Wasserstoff, Halogen, Cyano, Hydroxy, Mercapto, Azido, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenylthio, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio,



55

-ON=CR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -CR<sup>c</sup>=NOR<sup>a</sup>, -NR<sup>c</sup>N=CR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -NR<sup>c</sup>NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>,  
 -NOR<sup>a</sup>, -NR<sup>c</sup>C(=NR<sup>c'</sup>)NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -NR<sup>c</sup>C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -NR<sup>a</sup>C(=O)R<sup>c</sup>,  
 -NR<sup>a</sup>C(=NOR<sup>c</sup>)R<sup>c'</sup>, -OC(=O)R<sup>c</sup>, -C(=NOR<sup>c</sup>)NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>,  
 -CR<sup>c</sup>(=NNR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>), -C(=O)NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup> oder -C(=O)R<sup>c</sup>;

5

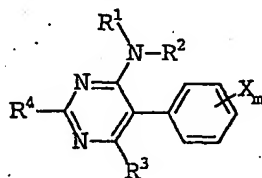
X Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl; und

m eine ganze Zahl von 1 bis 5.

10

2. 5-Phenylpyrimidine der Formel I gemäß Anspruch 1,

15



I

in der die Substituenten und der Index folgende Bedeutung haben:

20

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> unabhängig voneinander Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenacycloalkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkinyl,

25

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> können auch zusammen mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gesättigten oder ungesättigten fünf- oder sechsgliedrigen Ring bilden, der durch ein Sauerstoffatom unterbrochen sein und einen C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsubstituenten tragen kann oder in dem zwei benachbarte Kohlenstoffringglieder durch eine C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylengruppe verbrückt sein können;

30

R<sup>3</sup> Wasserstoff, Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy oder C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyloxy;

35

R<sup>4</sup> Wasserstoff, Halogen, Cyano, Hydroxy, Mercapto, Azido, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinyl-oxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenylthio, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkinylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, -ON=CR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -CR<sup>a</sup>=NOR<sup>b</sup>, -NR<sup>a</sup>N=CR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>, -NR<sup>a</sup>NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup> oder -NOR<sup>a</sup>;

40

45

$R^a, R^b$  unabhängig voneinander Wasserstoff,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_2$ - $C_8$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_8$ -Alkynyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy,

5  $C_3$ - $C_{10}$ -Cycloalkyl, Phenyl oder fünf- bis zehngliederiger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, wobei die cyclischen Reste teilweise oder vollständig substituirt sein können durch folgende Gruppen  $R^x$ :

15  $R^x$  unabhängig voneinander Cyano, Nitro, Amino, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, Halogen, Hydroxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylcarbonyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfonyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfoxy,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl-oxycarbonyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylamino, 20 Di- $C_1$ - $C_6$ -Alkylamino,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylaminocarbonyl, Di- $C_1$ - $C_6$ -Alkylaminocarbonyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylaminothiocarbonyl, Di- $C_1$ - $C_6$ -Alkylaminothiocarbonyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyloxy, Phenyl, Phenoxy, Benzyl, Benzyloxy, 5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl, 5- oder 6-gliedriges Hetaryl, 25 5- oder 6-gliedriges Hetaryloxy,  $C(=NOR^a)-OR^b$  oder  $OC(R^a)_2-C(R^b)=NOR^b$ ,

30 wobei die cyclischen Gruppen ihrerseits unsubstituiert oder substituiert sind durch einen bis drei Reste  $R^y$ :

35  $R^y$  Cyano, Nitro, Halogen, Hydroxy, Amino, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfonyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfoxy,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxycarbonyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylamino, Di- $C_1$ - $C_6$ -alkylamino, 40  $C_1$ - $C_6$ -Alkylaminocarbonyl, Di- $C_1$ - $C_6$ -alkylaminocarbonyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylaminothiocarbonyl, Di- $C_1$ - $C_6$ -alkylaminothiocarbonyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyloxy,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkenyl, Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Benzyl, Benzyloxy, 5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl,

45

57

5- oder 6-gliedriges Hetaryl, 5- oder  
6-gliedriges Hetaryloxy oder  $C(=NOR^a)-OR^b$ ;

$R^a, R^b$  Wasserstoff oder  $C_1-C_6$ -Alkyl;

5

X Halogen,  $C_1-C_6$ -Alkyl,  $C_1-C_6$ -Alkoxy oder  $C_1-C_6$ -Halogenalkyl; und

m eine ganze Zahl von 1 bis 5.

10

3. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der

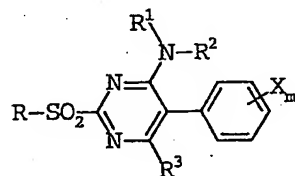
$R^4$  Wasserstoff, Cyano, Azido,  $C_1-C_6$ -Alkyl,  $C_2-C_8$ -Alkenyl,  
 $C_2-C_8$ -Alkynyl,  $C_1-C_6$ -Halogenalkyl,  $-CR^c=NOR^c$ ,  $-ON=CR^aR^b$   
15 oder  $-NR^cN=CR^aR^b$  oder  $-C(=NOR^c)NR^aR^b$ , bedeutet.

4. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der  $R^4$  für  
 $-ON=CR^aR^b$  steht.

20 5. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in der  $R^4$  für  
 $-CR^c=NOR^a$  steht.

6. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel gemäß  
Anspruch 1, in der  $R^4$  für Cyano oder eine über ein Heteroatom  
25 gebundene Gruppe steht, durch Umsetzung von Sulfonen der Formel II,

30



II

in der R für  $C_1-C_4$ -Alkyl steht, mit Verbindungen der Formel  
III,

35

 $R^4-H$ 

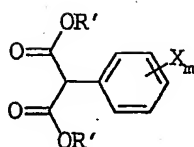
III

in der  $R^4$  die vorstehend gegebene Bedeutung hat, unter basischen Bedingungen.

40

7. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel gemäß  
Anspruch 1, in der  $R^3$  für Halogen und  $R^4$  für Wasserstoff, Alkyl,  
Alkenyl, Alkynyl oder Halogenalkyl steht, durch Umsetzung  
45 von Phenylmalonestern der Formel IV

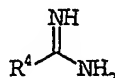
58



IV

5

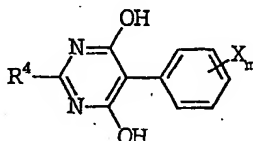
mit Amidinen der Formel V,



V

10

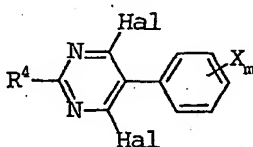
in der R<sup>4</sup> die vorstehend genannte Bedeutung hat, und Halogenierung der entstandenen Dihydroxypyrimidine VI



VI

15

mit Halogenierungsmitteln zu Dihalogenpyrimidinen VII,

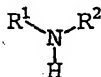


VII

20

in der Hal für Brom oder Chlor steht, die mit Aminen der Formel VIII,

25



VIII

in der R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> die für Formel I gegebene Bedeutung haben, zu Verbindungen der Formel I umgesetzt werden.

30

8. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel gemäß Anspruch 1, in der R<sup>3</sup> für Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy oder C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-Alkenyloxy steht, durch Umsetzung von Pyrimidinen der Formel I, in der R<sup>3</sup> für Halogen steht, mit Verbindungen der Formel IX

35



IX

40

in der R<sup>3</sup> die vorstehend genannte Bedeutung hat, unter basischen Bedingungen.

9. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel gemäß Anspruch 1, in der R<sup>3</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl steht, durch Umsetzung von Pyrimidinen der Formel I, in der R<sup>3</sup> für Halogen steht, mit metallorganischen Verbindungen der Formel X

45

$R^3-M$ 

X

5 in der M für eine Gruppe Mg-Hal, Zn- $R^3$  oder  $B(OR)_2$  steht, wobei Hal ein Halogenatom und R Wasserstoff oder  $C_1-C_4$ -Alkyl bedeutet und  $R^3$  für  $C_1-C_6$ -Alkyl steht.

10. Fungizides Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und eine Verbindung der Formel I gemäß den Ansprüchen 1 bis 5.

11. Verfahren zur Bekämpfung von phytopathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, daß man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder  
15 Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I gemäß den Ansprüchen 1 bis 5 behandelt.

20

25

30

35

40

45

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 02/12807

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07D239/46 C07D239/48 C07D239/42 C07D239/52 C07D403/12  
A01N43/54

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

CHEM ABS Data, EPO-Internal, PAJ

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category * | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages                    | Relevant to claim No. |
|------------|---|-----------------------|
| X          | EP 0 727 214 A (WELLCOME)<br>21 August 1996 (1996-08-21)<br>the whole document                        | 1,2                   |
| X          | WO 99 19305 A (KRENITSKY PHARMA.)<br>22 April 1999 (1999-04-22)<br>page 67, line 33 -page 71; claim 1 | 1,2                   |
| X          | US 5 597 827 A (ALISTAIR A. MILLER)<br>28 January 1997 (1997-01-28)<br>claims; examples               | 1,2                   |
| X          | US 5 591 746 A (ALISTAIR A. MILLER)<br>7 January 1997 (1997-01-07)<br>claims; examples                | 1,2                   |
|            | ---   |                       |
|            | -/--  |                       |

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

\* Special categories of cited documents:

\*A\* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

\*E\* earlier document but published on or after the international filing date

\*L\* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

\*O\* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

\*P\* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

\*T\* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

\*X\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

\*Y\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

\*G\* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

6 February 2003

Date of mailing of the international search report

24/02/2003

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Francois, J

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No.

PCT/EP 02/12807

## C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category * | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages   | Relevant to claim No. |
|------------|--|-----------------------|
| X          | CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 125, no. 17,<br>1996<br>Columbus, Ohio, US;<br>abstract no. 221864m,<br>page 1109; column 1;<br>XP002230224<br>abstract; figure I<br>& PL 169 025 A (POLITECHNIKA SLASKA)<br>31 May 1996 (1996-05-31) | 1,10                  |
| A          | CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 114, no. 5,<br>1991<br>Columbus, Ohio, US;<br>abstract no. 57530z,<br>page 247; column 1;<br>XP002230225<br>abstract<br>& JP 02 200678 A (KUMIAI)<br>8 August 1990 (1990-08-08)                       | 1,10                  |
| P,X        | WO 02 74753 A (BASF)<br>26 September 2002 (2002-09-26)<br>claims; figures I,VIII   | 1,2,10,<br>11         |
| P,X        | WO 01 96314 A (BASF)<br>20 December 2001 (2001-12-20)<br>claims; figure VIII   | 1,2,10,<br>11         |

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 02/12807

| Patent document<br>cited in search report |   | Publication<br>date | Patent family<br>member(s) | Publication<br>date |
|---|---|---------------------|----------------------------|---------------------|
| EP 727214                                 | A | 21-08-1996          | EP 0727212 A2              | 21-08-1996          |
|   |   |                     | EP 0727213 A2              | 21-08-1996          |
|   |   |                     | EP 0727214 A2              | 21-08-1996          |
|   |   |                     | EP 0713703 A2              | 29-05-1996          |
|   |   |                     | EP 0715851 A2              | 12-06-1996          |
|   |   |                     | AP 164 A                   | 12-01-1992          |
|   |   |                     | AT 144422 T                | 15-11-1996          |
|   |   |                     | AU 639216 B2               | 22-07-1993          |
|   |   |                     | AU 4596489 A               | 14-06-1990          |
|   |   |                     | AU 4915493 A               | 13-01-1994          |
|   |   |                     | AU 5195296 A               | 18-07-1996          |
|   |   |                     | AU 5195396 A               | 04-07-1996          |
|   |   |                     | AU 690443 B2               | 23-04-1998          |
|   |   |                     | AU 5195596 A               | 04-07-1996          |
|   |   |                     | AU 5195696 A               | 04-07-1996          |
|   |   |                     | CA 2004747 A1              | 07-06-1990          |
|   |   |                     | CN 1052306 A               | 19-06-1991          |
|   |   |                     | CN 1119099 A               | 27-03-1996          |
|   |   |                     | CN 1115756 A ,B            | 31-01-1996          |
|   |   |                     | CN 1113487 A ,B            | 20-12-1995          |
|   |   |                     | CN 1117046 A               | 21-02-1996          |
|   |   |                     | DD 292250 A5               | 25-07-1991          |
|   |   |                     | DE 68927368 D1             | 28-11-1996          |
|   |   |                     | DK 90399 A                 | 24-06-1999          |
|   |   |                     | DK 613289 A                | 08-06-1990          |
|   |   |                     | EP 0372934 A2              | 13-06-1990          |
|   |   |                     | ES 2095842 T3              | 01-03-1997          |
|   |   |                     | FI 955939 A                | 11-12-1995          |
|   |   |                     | FI 955940 A                | 11-12-1995          |
|   |   |                     | FI 955941 A                | 11-12-1995          |
|   |   |                     | GR 3022031 T3              | 31-03-1997          |
|   |   |                     | HK 1004092 A1              | 13-11-1998          |
|   |   |                     | HU 55764 A2                | 28-06-1991          |
|   |   |                     | HU 9500740 A3              | 28-11-1995          |
|   |   |                     | HU 9500754 A3              | 28-11-1995          |
|   |   |                     | IE 80711 B1                | 16-12-1998          |
|   |   |                     | IL 92558 A                 | 31-01-1996          |
|   |   |                     | IL 111627 A                | 10-06-1997          |
|   |   |                     | IL 114335 A                | 06-12-2000          |
|   |   |                     | JP 2202876 A               | 10-08-1990          |
|   |   |                     | JP 2795498 B2              | 10-09-1998          |
|   |   |                     | KR 145308 B1               | 15-07-1998          |
|   |   |                     | LT 269 A ,B                | 25-10-1994          |
|   |   |                     | LV 10442 A ,B              | 20-02-1995          |
|   |   |                     | MC 2076 A                  | 12-10-1990          |
|   |   |                     | MX 9203422 A1              | 01-07-1992          |
| WO 9919305                                | A | 22-04-1999          | AU 9693998 A               | 03-05-1999          |
|   |   |                     | CA 2305255 A1              | 22-04-1999          |
|   |   |                     | EP 1025091 A1              | 09-08-2000          |
|   |   |                     | JP 2001519416 T            | 23-10-2001          |
|   |   |                     | WO 9919305 A2              | 22-04-1999          |
|   |   |                     | US 6440965 B1              | 27-08-2002          |
| US 5597827                                | A | 28-01-1997          | AP 164 A                   | 12-01-1992          |
|   |   |                     | AT 144422 T                | 15-11-1996          |
|   |   |                     | AU 639216 B2               | 22-07-1993          |
|   |   |                     | AU 4596489 A               | 14-06-1990          |



# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 02/12807

| Patent document<br>cited in search report |   | Publication<br>date | Patent family<br>member(s) | Publication<br>date |
|---|---|---------------------|----------------------------|---------------------|
| US 5597827                                | A |                     | AU 4915493 A               | 13-01-1994          |
|   |   |                     | AU 5195296 A               | 18-07-1996          |
|   |   |                     | AU 5195396 A               | 04-07-1996          |
|   |   |                     | AU 690443 B2               | 23-04-1998          |
|   |   |                     | AU 5195596 A               | 04-07-1996          |
|   |   |                     | AU 5195696 A               | 04-07-1996          |
|   |   |                     | CA 2004747 A1              | 07-06-1990          |
|   |   |                     | CN 1052306 A               | 19-06-1991          |
|   |   |                     | CN 1119099 A               | 27-03-1996          |
|   |   |                     | CN 1115756 A ,B            | 31-01-1996          |
|   |   |                     | CN 1113487 A ,B            | 20-12-1995          |
|   |   |                     | CN 1117046 A               | 21-02-1996          |
|   |   |                     | DD 292250 A5               | 25-07-1991          |
|   |   |                     | DE 68927368 D1             | 28-11-1996          |
|   |   |                     | DK 90399 A                 | 24-06-1999          |
|   |   |                     | DK 613289 A                | 08-06-1990          |
|   |   |                     | EP 0372934 A2              | 13-06-1990          |
|   |   |                     | EP 0727212 A2              | 21-08-1996          |
|   |   |                     | EP 0727213 A2              | 21-08-1996          |
|   |   |                     | EP 0727214 A2              | 21-08-1996          |
|   |   |                     | EP 0713703 A2              | 29-05-1996          |
|   |   |                     | EP 0715851 A2              | 12-06-1996          |
|   |   |                     | ES 2095842 T3              | 01-03-1997          |
|   |   |                     | FI 955939 A                | 11-12-1995          |
|   |   |                     | FI 955940 A                | 11-12-1995          |
|   |   |                     | FI 955941 A                | 11-12-1995          |
|   |   |                     | GR 3022031 T3              | 31-03-1997          |
|   |   |                     | HK 1004092 A1              | 13-11-1998          |
|   |   |                     | HU 55764 A2                | 28-06-1991          |
|   |   |                     | HU 9500740 A3              | 28-11-1995          |
|   |   |                     | HU 9500754 A3              | 28-11-1995          |
|   |   |                     | IE 80711 B1                | 16-12-1998          |
|   |   |                     | IL 92558 A                 | 31-01-1996          |
|   |   |                     | IL 111627 A                | 10-06-1997          |
|   |   |                     | IL 114335 A                | 06-12-2000          |
|   |   |                     | JP 2202876 A               | 10-08-1990          |
|   |   |                     | JP 2795498 B2              | 10-09-1998          |
|   |   |                     | KR 145308 B1               | 15-07-1998          |
|   |   |                     | LT 269 A ,B                | 25-10-1994          |
|   |   |                     | LV 10442 A ,B              | 20-02-1995          |
|   |   |                     | MC 2076 A                  | 12-10-1990          |
| US 5591746                                | A | 07-01-1997          | AP 164 A                   | 12-01-1992          |
|   |   |                     | AT 144422 T                | 15-11-1996          |
|   |   |                     | AU 639216 B2               | 22-07-1993          |
|   |   |                     | AU 4596489 A               | 14-06-1990          |
|   |   |                     | AU 4915493 A               | 13-01-1994          |
|   |   |                     | AU 5195296 A               | 18-07-1996          |
|   |   |                     | AU 5195396 A               | 04-07-1996          |
|   |   |                     | AU 690443 B2               | 23-04-1998          |
|   |   |                     | AU 5195596 A               | 04-07-1996          |
|   |   |                     | AU 5195696 A               | 04-07-1996          |
|   |   |                     | CA 2004747 A1              | 07-06-1990          |
|   |   |                     | CN 1052306 A               | 19-06-1991          |
|   |   |                     | CN 1119099 A               | 27-03-1996          |
|   |   |                     | CN 1115756 A ,B            | 31-01-1996          |
|   |   |                     | CN 1113487 A ,B            | 20-12-1995          |
|   |   |                     | CN 1117046 A               | 21-02-1996          |

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 02/12807

| Patent document<br>cited in search report |   | Publication<br>date | Patent family<br>member(s) | Publication<br>date |
|---|---|---------------------|----------------------------|---------------------|
| US 5591746                                | A |                     | DD 292250 A5               | 25-07-1991          |
|   |   |                     | DE 68927368 D1             | 28-11-1996          |
|   |   |                     | DK 90399 A                 | 24-06-1999          |
|   |   |                     | DK 613289 A                | 08-06-1990          |
|   |   |                     | EP 0372934 A2              | 13-06-1990          |
|   |   |                     | EP 0727212 A2              | 21-08-1996          |
|   |   |                     | EP 0727213 A2              | 21-08-1996          |
|   |   |                     | EP 0727214 A2              | 21-08-1996          |
|   |   |                     | EP 0713703 A2              | 29-05-1996          |
|   |   |                     | EP 0715851 A2              | 12-06-1996          |
|   |   |                     | ES 2095842 T3              | 01-03-1997          |
|   |   |                     | FI 955939 A                | 11-12-1995          |
|   |   |                     | FI 955940 A                | 11-12-1995          |
|   |   |                     | FI 955941 A                | 11-12-1995          |
|   |   |                     | GR 3022031 T3              | 31-03-1997          |
|   |   |                     | HK 1004092 A1              | 13-11-1998          |
|   |   |                     | HU 55764 A2                | 28-06-1991          |
|   |   |                     | HU 9500740 A3              | 28-11-1995          |
|   |   |                     | HU 9500754 A3              | 28-11-1995          |
|   |   |                     | IE 80711 B1                | 16-12-1998          |
|   |   |                     | IL 92558 A                 | 31-01-1996          |
|   |   |                     | IL 111627 A                | 10-06-1997          |
|   |   |                     | IL 114335 A                | 06-12-2000          |
|   |   |                     | JP 2202876 A               | 10-08-1990          |
|   |   |                     | JP 2795498 B2              | 10-09-1998          |
|   |   |                     | KR 145308 B1               | 15-07-1998          |
|   |   |                     | LT 269 A ,B                | 25-10-1994          |
|   |   |                     | LV 10442 A ,B              | 20-02-1995          |
|   |   |                     | MC 2076 A                  | 12-10-1990          |
| PL 169025                                 | A | 30-05-1994          | PL 296745 A1               | 30-05-1994          |
| JP 02200678                               | A | 08-08-1990          | NONE                       |                     |
| WO 0274753                                | A | 26-09-2002          | WO 02074753 A2             | 26-09-2002          |
| WO 0196314                                | A | 20-12-2001          | AU 7056401 A               | 24-12-2001          |
|   |   |                     | WO 0196314 A1              | 20-12-2001          |

PCT/EP 02/12807

Formblatt PCT/SA/210 (Blatt 2) (Juli 1992)

# INTERNATIONALES RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 02/12807

| C(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN |   |                    |
|---|---|--------------------|
| Kategorie*  | Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile  | Betr. Anspruch Nr. |
| X   | CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 125, no. 17,<br>1996<br>Columbus, Ohio, US;<br>abstract no. 221864m,<br>Seite 1109; Spalte 1;<br>XP002230224<br>Zusammenfassung; Abbildung I<br>& PL 169 025 A (POLITECHNIKA SLASKA)<br>31. Mai 1996 (1996-05-31)<br>--- | 1,10               |
| A   | CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 114, no. 5,<br>1991<br>Columbus, Ohio, US;<br>abstract no. 57530z,<br>Seite 247; Spalte 1;<br>XP002230225<br>Zusammenfassung<br>& JP 02 200678 A (KUMIAI)<br>8. August 1990 (1990-08-08)<br>---                          | 1,10               |
| P,X   | WO 02 74753 A (BASF)<br>26. September 2002 (2002-09-26)<br>Ansprüche; Abbildungen I, VIII<br>---  | 1,2,10,<br>11      |
| P,X   | WO 01 96314 A (BASF)<br>20. Dezember 2001 (2001-12-20)<br>Ansprüche; Abbildung VIII<br>-----  | 1,2,10,<br>11      |

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 02/12807

| Im Recherchenbericht<br>angeführtes Patentdokument | Datum der<br>Veröffentlichung | Mitglied(er) der<br>Patentfamilie | Datum der<br>Veröffentlichung |
|--|-------------------------------|-----------------------------------|-------------------------------|
| EP 727214 A  | 21-08-1996                    | EP 0727212 A2                     | 21-08-1996                    |
|  |                               | EP 0727213 A2                     | 21-08-1996                    |
|  |                               | EP 0727214 A2                     | 21-08-1996                    |
|  |                               | EP 0713703 A2                     | 29-05-1996                    |
|  |                               | EP 0715851 A2                     | 12-06-1996                    |
|  |                               | AP 164 A                          | 12-01-1992                    |
|  |                               | AT 144422 T                       | 15-11-1996                    |
|  |                               | AU 639216 B2                      | 22-07-1993                    |
|  |                               | AU 4596489 A                      | 14-06-1990                    |
|  |                               | AU 4915493 A                      | 13-01-1994                    |
|  |                               | AU 5195296 A                      | 18-07-1996                    |
|  |                               | AU 5195396 A                      | 04-07-1996                    |
|  |                               | AU 690443 B2                      | 23-04-1998                    |
|  |                               | AU 5195596 A                      | 04-07-1996                    |
|  |                               | AU 5195696 A                      | 04-07-1996                    |
|  |                               | CA 2004747 A1                     | 07-06-1990                    |
|  |                               | CN 1052306 A                      | 19-06-1991                    |
|  |                               | CN 1119099 A                      | 27-03-1996                    |
|  |                               | CN 1115756 A ,B                   | 31-01-1996                    |
|  |                               | CN 1113487 A ,B                   | 20-12-1995                    |
|  |                               | CN 1117046 A                      | 21-02-1996                    |
|  |                               | DD 292250 A5                      | 25-07-1991                    |
|  |                               | DE 68927368 D1                    | 28-11-1996                    |
|  |                               | DK 90399 A                        | 24-06-1999                    |
|  |                               | DK 613289 A                       | 08-06-1990                    |
|  |                               | EP 0372934 A2                     | 13-06-1990                    |
|  |                               | ES 2095842 T3                     | 01-03-1997                    |
|  |                               | FI 955939 A                       | 11-12-1995                    |
|  |                               | FI 955940 A                       | 11-12-1995                    |
|  |                               | FI 955941 A                       | 11-12-1995                    |
|  |                               | GR 3022031 T3                     | 31-03-1997                    |
|  |                               | HK 1004092 A1                     | 13-11-1998                    |
|  |                               | HU 55764 A2                       | 28-06-1991                    |
|  |                               | HU 9500740 A3                     | 28-11-1995                    |
|  |                               | HU 9500754 A3                     | 28-11-1995                    |
|  |                               | IE 80711 B1                       | 16-12-1998                    |
|  |                               | IL 92558 A                        | 31-01-1996                    |
|  |                               | IL 111627 A                       | 10-06-1997                    |
|  |                               | IL 114335 A                       | 06-12-2000                    |
|  |                               | JP 2202876 A                      | 10-08-1990                    |
|  |                               | JP 2795498 B2                     | 10-09-1998                    |
|  |                               | KR 145308 B1                      | 15-07-1998                    |
|  |                               | LT 269 A ,B                       | 25-10-1994                    |
|  |                               | LV 10442 A ,B                     | 20-02-1995                    |
|  |                               | MC 2076 A                         | 12-10-1990                    |
|  |                               | MX 9203422 A1                     | 01-07-1992                    |
| WO 9919305 A                                       | 22-04-1999                    | AU 9693998 A                      | 03-05-1999                    |
|  |                               | CA 2305255 A1                     | 22-04-1999                    |
|  |                               | EP 1025091 A1                     | 09-08-2000                    |
|  |                               | JP 2001519416 T                   | 23-10-2001                    |
|  |                               | WO 9919305 A2                     | 22-04-1999                    |
|  |                               | US 6440965 B1                     | 27-08-2002                    |
| US 5597827 A                                       | 28-01-1997                    | AP 164 A                          | 12-01-1992                    |
|  |                               | AT 144422 T                       | 15-11-1996                    |
|  |                               | AU 639216 B2                      | 22-07-1993                    |
|  |                               | AU 4596489 A                      | 14-06-1990                    |

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationaler Aktenzeichen

PCT/EP 02/12807

| Im Recherchenbericht<br>angeführtes Patentdokument | Datum der<br>Veröffentlichung | Mitglied(er) der<br>Patentfamilie | Datum der<br>Veröffentlichung |            |
|--|-------------------------------|-----------------------------------|-------------------------------|------------|
| US 5597827   | A                             | AU 4915493 A                      | 13-01-1994                    |            |
|  |                               | AU 5195296 A                      | 18-07-1996                    |            |
|  |                               | AU 5195396 A                      | 04-07-1996                    |            |
|  |                               | AU 690443 B2                      | 23-04-1998                    |            |
|  |                               | AU 5195596 A                      | 04-07-1996                    |            |
|  |                               | AU 5195696 A                      | 04-07-1996                    |            |
|  |                               | CA 2004747 A1                     | 07-06-1990                    |            |
|  |                               | CN 1052306 A                      | 19-06-1991                    |            |
|  |                               | CN 1119099 A                      | 27-03-1996                    |            |
|  |                               | CN 1115756 A ,B                   | 31-01-1996                    |            |
|  |                               | CN 1113487 A ,B                   | 20-12-1995                    |            |
|  |                               | CN 1117046 A                      | 21-02-1996                    |            |
|  |                               | DD 292250 A5                      | 25-07-1991                    |            |
|  |                               | DE 68927368 D1                    | 28-11-1996                    |            |
|  |                               | DK 90399 A                        | 24-06-1999                    |            |
|  |                               | DK 613289 A                       | 08-06-1990                    |            |
|  |                               | EP 0372934 A2                     | 13-06-1990                    |            |
|  |                               | EP 0727212 A2                     | 21-08-1996                    |            |
|  |                               | EP 0727213 A2                     | 21-08-1996                    |            |
|  |                               | EP 0727214 A2                     | 21-08-1996                    |            |
|  |                               | EP 0713703 A2                     | 29-05-1996                    |            |
|  |                               | EP 0715851 A2                     | 12-06-1996                    |            |
|  |                               | ES 2095842 T3                     | 01-03-1997                    |            |
|  |                               | FI 955939 A                       | 11-12-1995                    |            |
|  |                               | FI 955940 A                       | 11-12-1995                    |            |
|  |                               | FI 955941 A                       | 11-12-1995                    |            |
|  |                               | GR 3022031 T3                     | 31-03-1997                    |            |
|  |                               | HK 1004092 A1                     | 13-11-1998                    |            |
|  |                               | HU 55764 A2                       | 28-06-1991                    |            |
|  |                               | HU 9500740 A3                     | 28-11-1995                    |            |
|  |                               | HU 9500754 A3                     | 28-11-1995                    |            |
|  |                               | IE 80711 B1                       | 16-12-1998                    |            |
|  |                               | IL 92558 A                        | 31-01-1996                    |            |
|  |                               | IL 111627 A                       | 10-06-1997                    |            |
|  |                               | IL 114335 A                       | 06-12-2000                    |            |
|  |                               | JP 2202876 A                      | 10-08-1990                    |            |
|  |                               | JP 2795498 B2                     | 10-09-1998                    |            |
|  |                               | KR 145308 B1                      | 15-07-1998                    |            |
|  |                               | LT 269 A ,B                       | 25-10-1994                    |            |
|  |                               | LV 10442 A ,B                     | 20-02-1995                    |            |
|  |                               | MC 2076 A                         | 12-10-1990                    |            |
| US 5591746   | A                             | 07-01-1997                        | AP 164 A                      | 12-01-1992 |
|  |                               |                                   | AT 144422 T                   | 15-11-1996 |
|  |                               |                                   | AU 639216 B2                  | 22-07-1993 |
|  |                               |                                   | AU 4596489 A                  | 14-06-1990 |
|  |                               |                                   | AU 4915493 A                  | 13-01-1994 |
|  |                               |                                   | AU 5195296 A                  | 18-07-1996 |
|  |                               |                                   | AU 5195396 A                  | 04-07-1996 |
|  |                               |                                   | AU 690443 B2                  | 23-04-1998 |
|  |                               |                                   | AU 5195596 A                  | 04-07-1996 |
|  |                               |                                   | AU 5195696 A                  | 04-07-1996 |
|  |                               |                                   | CA 2004747 A1                 | 07-06-1990 |
|  |                               |                                   | CN 1052306 A                  | 19-06-1991 |
|  |                               |                                   | CN 1119099 A                  | 27-03-1996 |
|  |                               |                                   | CN 1115756 A ,B               | 31-01-1996 |
|  |                               |                                   | CN 1113487 A ,B               | 20-12-1995 |
|  |                               |                                   | CN 1117046 A                  | 21-02-1996 |

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 02/12807

| Im Recherchenbericht<br>angeführtes Patentdokument | Datum der<br>Veröffentlichung | Mitglied(er) der<br>Patentfamilie | Datum der<br>Veröffentlichung |
|--|-------------------------------|-----------------------------------|-------------------------------|
| US 5591746 A                                       |                               | DD 292250 A5                      | 25-07-1991                    |
|  |                               | DE 68927368 D1                    | 28-11-1996                    |
|  |                               | DK 90399 A                        | 24-06-1999                    |
|  |                               | DK 613289 A                       | 08-06-1990                    |
|  |                               | EP 0372934 A2                     | 13-06-1990                    |
|  |                               | EP 0727212 A2                     | 21-08-1996                    |
|  |                               | EP 0727213 A2                     | 21-08-1996                    |
|  |                               | EP 0727214 A2                     | 21-08-1996                    |
|  |                               | EP 0713703 A2                     | 29-05-1996                    |
|  |                               | EP 0715851 A2                     | 12-06-1996                    |
|  |                               | ES 2095842 T3                     | 01-03-1997                    |
|  |                               | FI 955939 A                       | 11-12-1995                    |
|  |                               | FI 955940 A                       | 11-12-1995                    |
|  |                               | FI 955941 A                       | 11-12-1995                    |
|  |                               | GR 3022031 T3                     | 31-03-1997                    |
|  |                               | HK 1004092 A1                     | 13-11-1998                    |
|  |                               | HU 55764 A2                       | 28-06-1991                    |
|  |                               | HU 9500740 A3                     | 28-11-1995                    |
|  |                               | HU 9500754 A3                     | 28-11-1995                    |
|  |                               | IE 80711 B1                       | 16-12-1998                    |
|  |                               | IL 92558 A                        | 31-01-1996                    |
|  |                               | IL 111627 A                       | 10-06-1997                    |
|  |                               | IL 114335 A                       | 06-12-2000                    |
|  |                               | JP 2202876 A                      | 10-08-1990                    |
|  |                               | JP 2795498 B2                     | 10-09-1998                    |
|  |                               | KR 145308 B1                      | 15-07-1998                    |
|  |                               | LT 269 A ,B                       | 25-10-1994                    |
|  |                               | LV 10442 A ,B                     | 20-02-1995                    |
|  |                               | MC 2076 A                         | 12-10-1990                    |
| PL 169025 A  | 30-05-1994                    | PL 296745 A1                      | 30-05-1994                    |
| JP 02200678 A                                      | 08-08-1990                    | KEINE                             |                               |
| WO 0274753 A                                       | 26-09-2002                    | WO 02074753 A2                    | 26-09-2002                    |
| WO 0196314 A                                       | 20-12-2001                    | AU 7056401 A                      | 24-12-2001                    |
|  |                               | WO 0196314 A1                     | 20-12-2001                    |